

PCT

世界知的所有権機関

国際事務局



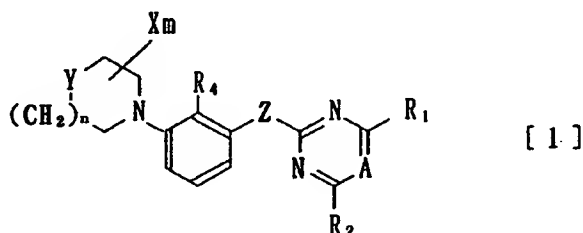
DP

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

<p>(51) 国際特許分類6</p> <p>C07D 239/42, 239/46, 239/47, 239/48, 251/34, 491/048, 251/38, 413/12, A01N 43/54, 43/60, 43/66</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO96/36613</p> <p>(43) 国際公開日 1996年11月21日(21.11.96)</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP96/01262</p> <p>(22) 国際出願日 1996年5月14日(14.05.96)</p> <p>(30) 優先権データ</p> <p>特願平7/145503 1995年5月19日(19.05.95) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について)</p> <p>日本曹達株式会社(NIPPON SODA CO., LTD.)(JP/JP)</p> <p>〒100 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 Tokyo, (JP)</p> <p>(72) 発明者; および</p> <p>(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ)</p> <p>植田昭嘉(UEDA, Akiyoshi)(JP/JP)</p> <p>宮澤靖之(MIYAZAWA, Yasuyuki)(JP/JP)</p> <p>佐藤大祐(SATO, Daisuke)(JP/JP)</p> <p>古口正巳(KOGUCHI, Masami)(JP/JP)</p> <p>松本勤子(MATSUMOTO, Isoko)(JP/JP)</p> <p>川名 貴(KAWANA, Takashi)(JP/JP)</p> <p>〒250-02 神奈川県小田原市高田345</p> <p>日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa, (JP)</p>		<p>(74) 代理人</p> <p>弁理士 東海裕作(TOKAI, Yusaku)</p> <p>〒100 東京都千代田区大手町2丁目2番1号</p> <p>日本曹達株式会社内 Tokyo, (JP)</p> <p>(81) 指定国</p> <p>BR, CN, JP, KR, US, 欧州特許(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>
<p>(54) Title : SUBSTITUTED BENZOIC ACID DERIVATIVES, PROCESS FOR THE PRODUCTION THEREOF, AND HERBICIDES</p> <p>(54) 発明の名称 置換安息香酸誘導体、その製造方法及び除草剤</p> <div data-bbox="578 1293 1068 1503" data-label="Chemical-Block"> <p style="text-align: center;">(I)</p> </div> <p>(57) Abstract</p> <p>Substituted benzoic acids of general formula (I) and salts thereof. They exhibit excellent herbicidal activity and crop selectivity, and therefore compositions containing the same are useful as a herbicide, wherein A is N or a carbon atom substituted with R₃; Z is O or S; R₁ and R₂ are each independently H, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₆ alkoxy, cyano or the like; R₃ is H, C₁-C₆ alkyl or halogeno; R₄ is COOR₇, CHO, COR₈, CH(R₉)OR₉, C(R₁₀)-NOR₁₀, COON-CR₁₁R₁₂, CR₁₃OR₁₄OR₁₅, CONR₁₆R₁₇ or CON-C(R₁₈)NR₁₉R₂₀; X is C₁-C₆ alkyl, C₃-C₇ cycloalkyl or the like; m is an integer of 0 to 4; Y is O, S, CR₂₁ or NR₂₂; and n is an integer or 0 to 3.</p>		

(57) 要約

本発明は、一般式〔1〕で表される置換安息香酸誘導体およびその塩である。
本発明化合物は、優れた除草活性、作物選択性を有するものであり、本発明化合物を含有する組成物は除草剤として有用である。



〔式中、Aは窒素原子またはR₃で置換された炭素原子を表し、Zは酸素原子または硫黄原子を表し、R₁、R₂は、それぞれ独立して水素原子、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、シアノ基等を表し、R₃は水素原子、C₁₋₆アルキルまたはハロゲン原子を表し、R₄は、COOR₇、CHO、COR₈、CH(R₉)OR₉、C(R₉)=NOR₁₀、COON=CR₁₁R₁₂、CR₁₃OR₁₄OR₁₅、CONR₁₆R₁₇、またはCON=C(R₁₈)NR₁₉R₂₀を表す。

Xは、C₁₋₆アルキル、C₃₋₇シクロアルキル等を表し、mは0または1~4の整数を表し、YはO、S、CR₂₁またはNR₂₂を表し、nは0~3の整数を表す。〕

情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願をパンフレット第一頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

AL	アルバニア	DE	ドイツ	LI	リヒテンシュタイン	PL	ポーランド
AM	アルメニア	DK	デンマーク	LC	セントルシア	PT	ポルトガル
AT	オーストリア	EE	エストニア	LK	スリランカ	RO	ルーマニア
AU	オーストラリア	ES	スペイン	LR	リベリア	RU	ロシア連邦
AZ	アゼルバイジャン	FI	フィンランド	LS	レソト	SD	スーダン
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	FR	フランス	LT	リトアニア	SE	スウェーデン
BB	バルバドス	GA	ガボン	LU	ルクセンブルグ	SG	シンガポール
BE	ベルギー	GB	イギリス	LV	ラトヴィア	SI	スロヴェニア
BF	ブルキナ・ファソ	GE	グルジア	MC	モナコ	SK	スロバキア
BG	ブルガリア	GN	ギニア	MD	モルドヴァ共和国	SN	セネガル
BJ	ベナン	GR	ギリシャ	MG	マダガスカル	SZ	スワジランド
BR	ブラジル	HU	ハンガリー	MK	マケドニア共和国	TD	チャド
BY	ベラルーシ	IE	アイルランド	VI	ヴァティカン共和国	TG	トーゴ
CA	カナダ	IL	イスラエル	ML	マリ	TJ	タジキスタン
CF	中央アフリカ共和国	IS	アイスランド	MN	モンゴル	TM	トルクメニスタン
CG	コンゴ	IT	イタリア	MR	モーリタニア	TR	トルコ
CH	スイス	JP	日本	MW	マラウイ	TT	トリニダード・トバゴ
CI	コート・ジボアール	KE	ケニア	MX	メキシコ	UA	ウクライナ
CM	カメルーン	KG	キルギスタン	NE	ニジェール	UG	ウガンダ
CN	中国	KP	朝鮮民主主義人民共和国	NL	オランダ	US	アメリカ合衆国
CU	キューバ	KR	大韓民国	NO	ノルウェー	UZ	ウズベキスタン
CZ	チェコ共和国	KZ	カザフスタン	NZ	ニュージーランド	VN	ヴィエトナム

明 細 書

置換安息香酸誘導体、その製造方法及び除草剤

技術分野：

本発明は新規な置換安息香酸誘導体、その製造方法及び除草剤に関する。

背景技術：

農園芸作物の栽培にあたり、多大の労力を必要としてきた雑草防除に多くの除草剤が使用されるようになってきた。しかし作物に薬害を生じたり、環境に残留したり、汚染したりすることから、より低い薬量で効果が確実でしかも安全に使用できる薬剤の開発が望まれている。

本発明化合物と関連して除草活性化合物を開示したものとして、例えば、特開平1-93576号公報には、除草活性を有するある種のフェノキシピリミジン誘導体が記載されている。

しかしながら、フェノキシピリミジン誘導体のベンゼン環の6位に含窒素ヘテロ環が窒素原子で結合した化合物については何ら具体的な記載はない。

本発明者らは鋭意研究した結果、フェノキシピリミジン誘導体あるいはその類縁化合物において、ベンゼン環6位にモルホリン、ピペリジン、ピペラジン、ピロリジンなどの含窒素ヘテロ環が窒素原子で結合した化合物が、特に優れた除草活性・作物選択性を有することを見出し、本発明を完成した。

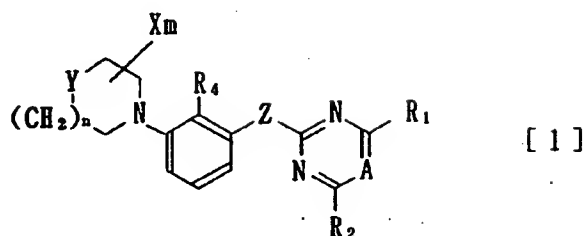
すなわち、本発明は上記した課題を解決して優れた除草活性を有し、安全に使用できる除草剤を提供することを目的とする。

発明の開示：

以下、本発明を詳細に説明する。

本発明は、一般式〔1〕で表される化合物もしくはその塩及びこれを含有する

除草剤である。



〔式中、Aは窒素原子、もしくはR₂で置換された炭素原子を表し、

Zは酸素、酸化されていても良い硫黄、置換されていても良い窒素、又は置換されていても良い炭素原子を表し、

R₁、R₂は各々独立して水素、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、ハロC₁₋₆アルコキシ、ハロC₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルアミノ、ジC₁₋₆アルキルアミノ、C₁₋₆アルキルチオ、ハロゲン、シアノ基を表し、

R₃は水素、C₁₋₆アルキル、ハロゲン、ニトロ、ホルミル、アシル基を表し、又、R₂とR₃は一緒になって環を形成していても良く、

R₄はCOOR₇、COSR₇、CHO、COR₈、CH(R₉)OR₉、C(R₈)=NOR₁₀、COON=CR₁₁R₁₂、CR₁₃OR₁₄OR₁₅、CONR₁₆R₁₇、及びCON=C(R₁₈)NR₁₉R₂₀を表す。又、安息香酸のアルカリ金属、アルカリ土類金属、アンモニウム塩等を表す。

Xは水素、C₁₋₆アルキル、C₆₋₇シクロアルキル、ハロC₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルチオC₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルスルホニルC₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、C₁₋₆アルキルアミノ、アシルアミノ、C₁₋₆アルキルスルホニルアミノ、イミノ、ヒドロキシル、カルボキシル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルコキシ、置換されても良いベンジルオキシ、C₂₋₆アルケニルオキシ、C₂₋₆アルキニルオキシ、ハロC₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルキルチオ、C₁₋₆アルキルスルホニル、C₂₋₆アルケニルチオ、C₂₋₆アル

キニルチオ、アシルオキシ、カルバモイルオキシ、チオカルバモイルオキシ、アミノオキシ、置換されても良いベンジル、置換されても良いフェニル、置換されても良いフェニルチオ、置換されても良いフェニルスルホニル、置換されても良いベンゾイル、又は置換されても良いヘテロ環オキシおよびヘテロ環チオ基を表し、

又、2つのXで炭素環、又は複素環を形成してもよく、mは1～4の整数を表し、

YはO、S、CO、CS、CR、R、C=NR、またはNRを表し、

nは0～3の整数を表し、

R、Rは各々独立して水素、C₁₋₆ アルキル、C₃₋₇ シクロアルキル、ハロC₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシC₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルチオC₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルスルホニルC₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、C₁₋₆ アルキルアミノ、アシルアミノ、C₁₋₆ アルキルスルホニルアミノ、ヒドロキシル、カルボキシル、C₁₋₆ アルコキシカルボニル、C₁₋₆ アルコキシ、置換されても良いベンジルオキシ、C₂₋₆ アルケニルオキシ、C₂₋₆ アルキニルオキシ、ハロC₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ アルキルチオ、C₁₋₆ アルキルスルホニル、C₂₋₆ アルケニルチオ、C₂₋₆ アルキニルチオ、アシルオキシ、カルバモイルオキシ、チオカルバモイルオキシ、アミノオキシ、置換されても良いベンジル、置換されても良いフェニル、置換されても良いフェニルチオ、置換されても良いフェニルスルホニル、置換されても良いベンゾイル、又は置換されても良いヘテロ環オキシおよびヘテロ環チオ基を表し、又、RとRは一緒になって環を形成しても良く、

Rは水素、C₁₋₆ アルキル、C₃₋₇ シクロアルキル、ハロC₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシC₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルチオC₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルスルホニルC₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、アシル、C₁₋₆ アルコキシカルボニル、C₁₋₆ アルキルスルホニル、C₂₋₆ アルケニルチオ、C₂₋₆ アルキニルチオ、アシルオキシ、カルバモイル、チオカルバモ

イル、置換されても良いベンジル、置換されても良いフェニル、置換されても良いヘテロ環、置換されても良いフェニルスルホニル、置換されても良いベンゾイル、又は置換されても良いヘテロ環カルボニル基を表し、

R₇ は水素、C₁₋₆ アルキル、C₃₋₇ シクロアルキル、ハロ C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ アルキル、フェノキシ C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルチオ C₁₋₆ アルキル、フェニルチオ C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルスルフィニル C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルスルホニル C₁₋₆ アルキル、フェニルスルホニル C₁₋₆ アルキル、ハロ C₁₋₆ アルキルスルホニル C₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₃₋₆ アルキニル、シアノ C₁₋₆ アルキル、アミノ C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシカルボニル C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アシルオキシ C₁₋₆ アルキル、ベンゾイルオキシ C₁₋₆ アルキル、ヘテロ環で置換されたカルボニルオキシ C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシカルボニルオキシ C₁₋₆ アルキル、チオ C₁₋₆ アシルオキシ C₁₋₆ アルキル、モノアルキルアミノ、アシルアミノ、アルキリデンアミノ、置換されても良いベンジル、置換されても良いフェニル、ヘテロ環基を表し、

R₈ は C₁₋₆ アルキル、C₃₋₇ シクロアルキル、ハロ C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルチオ C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルスルホニル C₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、アシル、C₁₋₆ アルコキシカルボニル、C₁₋₆ アルキルチオ、C₂₋₆ アルケニルチオ、C₂₋₆ アルキニルチオ、置換されても良いベンジル、置換されても良いフェニル、置換されても良いヘテロ環、置換されても良いベンゾイル、又は置換されても良いヘテロ環カルボニル基を表し、

R₉ 及び R₁₀ はそれぞれ独立して、水素、C₁₋₆ アルキル、C₃₋₇ シクロアルキル、ハロ C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルチオ C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルスルホニル C₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、アシル、C₁₋₆ アルコキシカルボニル、C₁₋₆ アルキルスルホニル、カルバモイル、チオカルバモイル、置換されても良いベンジル、

置換されても良いフェニル、置換されても良いヘテロ環、置換されても良いフェニルスルホニル、置換されても良いベンゾイル、又は置換されても良いヘテロ環カルボニル基を表し、

R_{11} 及び R_{12} はそれぞれ独立して、水素、 C_{1-8} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル、ハロ C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルコキシ C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルキルチオ C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルキルスルホニル C_{1-8} アルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{2-8} アルキニル、アシル、 C_{1-6} アルコシカルボニル、置換されても良いベンジル、置換されても良いフェニル、置換されても良いヘテロ環、置換されても良いベンゾイル、又は置換されても良いヘテロ環カルボニル基を表し、又、 R_{11} と R_{12} で環を形成しても良い。

R_{13} は水素、 C_{1-8} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル、ハロ C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルコキシ C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルキルチオ C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルキルスルホニル C_{1-8} アルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{2-8} アルキニル、 C_{1-6} アルコシカルボニル、置換されても良いベンジル、置換されても良いフェニル、置換されても良いヘテロ環を表し、

R_{14} 及び R_{15} はそれぞれ独立して、 C_{1-8} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル、ハロ C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルコキシ C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルキルチオ C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルキルスルホニル C_{1-8} アルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{2-8} アルキニル基を表し、又、 R_{14} と R_{15} で環を形成しても良い。

R_{16} 及び R_{17} はそれぞれ独立して、水素、 C_{1-8} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル、ハロ C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルコキシ C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルキルチオ C_{1-8} アルキル、 C_{1-8} アルキルスルホニル C_{1-8} アルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{2-8} アルキニル、アシル、 C_{1-6} アルコシカルボニル、 C_{1-8} アルキルスルホニル、カルバモイル、チオカルバモイル、置換されても良いベンジル、置換されても良いフェニル、置換されても良いヘテロ環、置換されても良いフェニルスルホニル、置換されても良いベンゾイル、又は置換されても良いヘテロ環カルボニル基を表し、又、 R_{16} と R_{17} で環を形成しても良い。

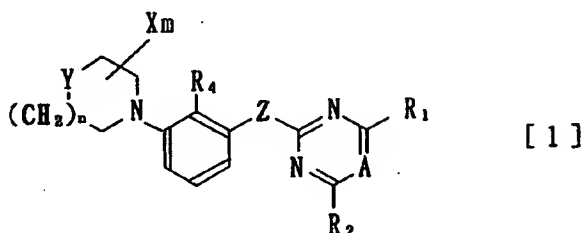
R₁₈は水素、C₁₋₆ アルキル、C₃₋₇ シクロアルキル、ハロC₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシC₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルチオC₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルスルホニルC₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、ハロゲン、シアノ、アミノ、C₁₋₆ アルキルアミノ、アシルアミノ、C₁₋₆ アルキルスルホニルアミノ、ヒドロキシル、C₁₋₆ アルコキシカルボニル、C₁₋₆ アルコキシ、置換されても良いベンジルオキシ、C₂₋₆ アルケニルオキシ、C₂₋₆ アルキニルオキシ、ハロC₁₋₆ アルコキシ、C₁₋₆ アルキルチオ、C₁₋₆ アルキルスルホニル、C₂₋₆ アルケニルチオ、C₂₋₆ アルキニルチオ、アシルオキシ、カルバモイルオキシ、チオカルバモイルオキシ、アミノオキシ、置換されても良いベンジル、置換されても良いフェニル、置換されても良いヘテロ環、置換されても良いフェニルチオ、置換されても良いフェニルスルホニル、置換されても良いベンゾイル、又は置換されても良いヘテロ環オキシおよびヘテロ環チオ基を表し、

R₁₉及びR₂₀はそれぞれ独立して、水素、C₁₋₆ アルキル、C₃₋₇ シクロアルキル、ハロC₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルコキシC₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルチオC₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ アルキルスルホニルC₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、アシル、C₁₋₆ アルコキシカルボニル、C₁₋₆ アルキルスルホニル、カルバモイル、チオカルバモイル、置換されても良いベンジル、置換されても良いフェニル、置換されても良いヘテロ環、置換されても良いフェニルスルホニル、置換されても良いベンゾイル、又は置換されても良いヘテロ環カルボニル基を表し、又、R₁₉とR₂₀で炭素環、又は複素環を形成しても良い。

]

以下、本発明の化合物を詳細に説明する。

本発明化合物は一般式〔I〕で表される化合物もしくはその塩である。



一般式〔I〕において、 R_1 および R_2 は、それぞれ独立して、水素原子、メチル、エチル、プロピル、イソプロピルなどの $C_1 \sim 6$ アルキル基、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ基などの $C_1 \sim 6$ アルコキシ基、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル基などのハロ $C_1 \sim 6$ アルキル基、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ基などのハロ $C_1 \sim 6$ アルコキシ基、メチルアミノ、エチルアミノなどの $C_1 \sim 6$ アルキルアミノ基、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、メチルエチルアミノ、メチルフェニルアミノなどのジ $C_1 \sim 6$ アルキルアミノ基、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオなどの $C_1 \sim 6$ アルキルチオ基、フッ素、塩素、臭素などのハロゲン原子またはシアノ基を表す。

R_3 は水素原子、メチル、エチル、プロピル、イソプロピルなどの $C_1 \sim 6$ アルキル基またはフッ素、塩素、臭素などのハロゲン原子を表し、また、 R_2 と R_3 は一緒になって環を形成していても良い。

R_4 は、カルボキシル基、 CO_2M (M は、ナトリウム、カリウムなどのアルカリ金属イオン、マグネシウム、カルシウムなどのアルカリ土類金属イオン、アンモニウムイオンなどを表す。)、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル基などの $COOR_7$ で表される基、メチルチオカルボニル、エチルチオカルボニル、プロピルチオカルボニル

、イソプロピルチオカルボニル基などの COSR_7 で表される基、ホルミル基、アセチル、プロピオニル基などの COR_8 で表されるアシル基、ヒドロキシメチル基、1-ヒドロキシエチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシプロピル基、2-ヒドロキシプロピル基、3-ヒドロキシプロピル基、1-ヒドロキシイソプロピル基、2-ヒドロキシイソプロピル基、3-ヒドロキシイソプロピル基などの $\text{CH(R}_9\text{)OH}$ で表される基、 $\text{C(R}_9\text{)=NOR}_{10}$ で表されるオキシム基(R_{10} はメチル、エチル、プロピルなどの C_{1-6} アルキル基、アリルなどの C_{2-6} アルケニル基を表す。)、 $\text{COON=CR}_{11}\text{R}_{12}$ で表される基(R_{11} と R_{12} はそれぞれメチル、エチル、プロピルなどの C_{1-6} アルキル基、アリルなどの C_{2-6} アルケニル基を表し、または結合して環を形成していてもよい)、メトキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシメチル基、エトキシエチル基、プロポキシメチル基、プロポキシエチル基などの $\text{CH(R}_9\text{)OR}_9$ で表される基、ジメチルアセタール基、ジエチルアセタール基、1,3-ジオキソラン-2-イル、1,3-ジオキソラン-2-メチル-2-イル、1,3-ジオキソラン-2-エチル-2-イル、1,3-ジオキサラン-2-イル、1,3-ジオキサラン-2-メチル-2-イル、1,1-ジメトキシエチル基、1,1-ジエトキシエチル基、1,1-ジメトキシプロピルなどの $\text{CR}_{13}\text{OR}_{14}\text{OR}_{15}$ で表されるアセタール基もしくはケタール基(R_{13} 、 R_{14} 、 R_{15} はそれぞれメチル、エチル、プロピルなどの C_{1-6} アルキル基、アリルなどの C_{2-6} アルケニル基を表す。)、メチルカルバモイル、ジメチルカルバモイル、エチルカルバモイル、ジエチルカルバモイルなどの $\text{CONR}_{16}\text{R}_{17}$ で表される基(R_{16} 、 R_{17} はそれぞれメチル、エチル、プロピルなどの C_{1-6} アルキル基、アリルなどの C_{2-6} アルケニル基を表す。)、または $\text{CON=C(R}_{18}\text{)NR}_{19}\text{R}_{20}$ (R_{18} 、 R_{19} 、 R_{20} はそれぞれメチル、エチル、プロピルなどの C_{1-6} アルキル基、アリルなどの C_{2-6} アルケニル基を表す。)で表される基を表す。

Xの例として、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基などのアルキル基、トリフルオロメチル基などのハロアルキル基、シクロプロピル基、シク

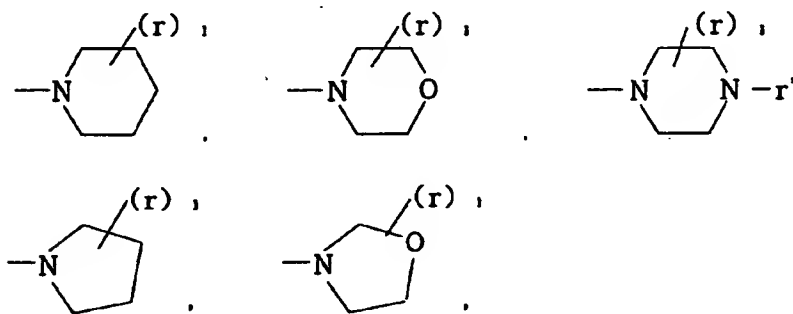
ロヘキシル基などのシクロアルキル基、塩素原子、フッ素原子などのハロゲン原子、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基などのN-置換アミノ基、メトキシ基、エトキシ基などのアルコキシ基、トリフルオロメトキシ基などのハロアルコキシ基、メトキシカルボニル、エトキシカルボニルなどのアルコキシカルボニル基、メチルチオ、エチルチオなどのアルキルチオ基、メチルスルホニル、エチルスルホニルなどのアルキルスルホニル基、ベンジル基などのアラルキル基、フェニル基、フェニルチオ基、ベンゾイル基などが挙げられる。

また、mが2以上のとき、Xは同一又は相異なってもよく、2つのXで炭素環または複素環を形成してもよく、mは0または1～4の整数を表す。

YはO、S、CO、CS、CR、R、C=NR、またはNRを表し、nは0～3の整数を表す。

本発明化合物は、一般式〔I〕においてベンゼン環の6位の位置に含窒素ヘテロ環がN-置換されていることにその構造状の特徴を有する。

一般式〔I〕において、ベンゼン環の6位の位置に結合する含窒素ヘテロ環基として、5乃至6員環のものが好ましく、例えば、以下の含窒素ヘテロ環基を挙げることができる。

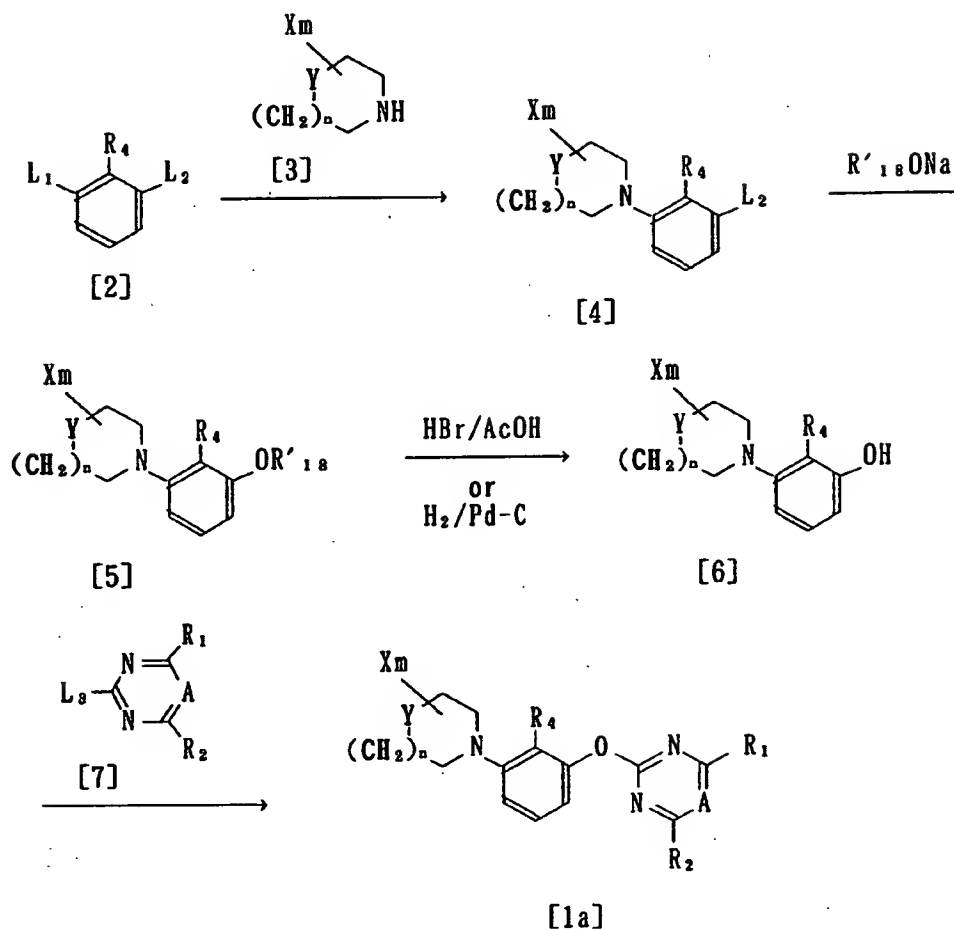


(式中、r、r' は、それぞれ低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、アルコキシカルボニル基などを表す。)

発明を実施するための最良の形態：

本発明の化合物は、次の方法によって製造することが出来る。

(製造法－１)



すなわち、一般式 [2] (式中、 R_4 は前記と同じ意味を表し、 L_1 、 L_2 はハロゲン原子又はニトロ基を表し、好ましくは L_1 はフッ素である。)の化合物と、一般式 [3] (式中、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。)の化合物とを、有機溶媒中で塩基の存在下カップリングさせ、一般式 [4] (式中、 R_4 、 L_2 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。)の化合物を合成する。

反応に用いられる塩基としては、水素化ナトリウム等の水素化金属類、炭酸カリウム等の炭酸塩類、トリエチルアミン等の有機塩基類である。

また、用いられる溶媒としては、DMF、DMSO、THF、DME等が挙げられるが、無溶媒で行うことも出来る。

反応混合物は反応が完了するまで、0～150℃、場合によっては一般式〔3〕（式中、X、Y、m、nは前記と同じ意味を表す。）の化合物の沸点で撹拌される。

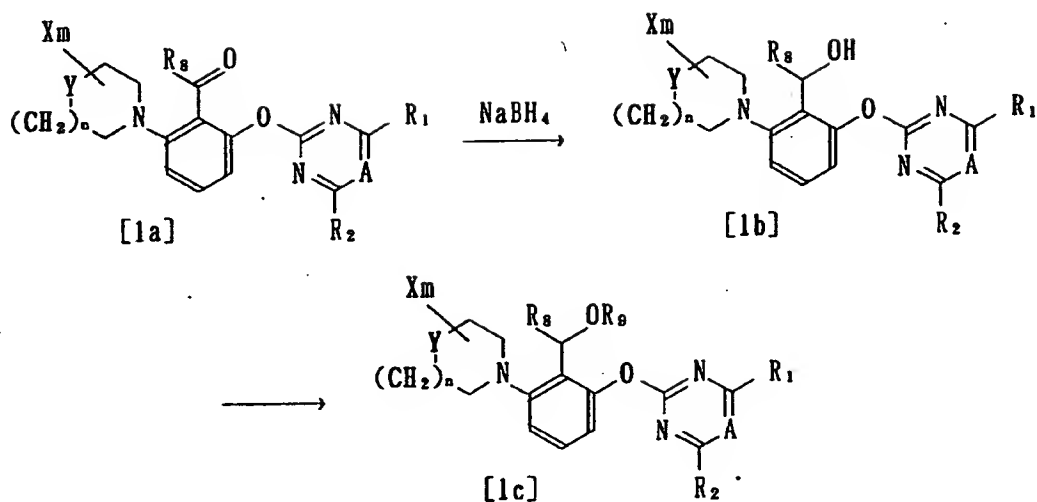
次に、得られた一般式〔4〕（式中、R₄、L₂、X、Y、m、nは前記と同じ意味を表す。）の化合物に、アルコラート（式中、R'はC₁～₆アルキル又はベンジルを表す。）を有機溶媒中、反応させて一般式〔5〕（式中、R'、R₄、L₂、X、Y、m、nは前記と同じ意味を表す。）の化合物を得る。

又、一般式〔5〕の化合物は一般式〔4〕の化合物に、塩基の存在下、アルコールと反応させることによっても得ることが出来る。用いられる塩基としては、水素化ナトリウム等の水素化金属類、炭酸カリウム等の炭酸塩類、トリエチルアミン等の有機塩基類であり、溶媒としては、DMF、DMSO、THF、DME等が使用することができる。反応混合物は反応が完了するまで、0～150℃で撹拌される。

得られた一般式〔5〕（式中、R'、R₄、L₂、X、Y、m、nは前記と同じ意味を表す。）の化合物を常法（例えば、HBr／酢酸による酸分解又は還元）に従い、フェノール化合物、一般式〔6〕（式中、R₄、L₂、X、Y、m、nは前記と同じ意味を表す。）の化合物へ導くことができる。

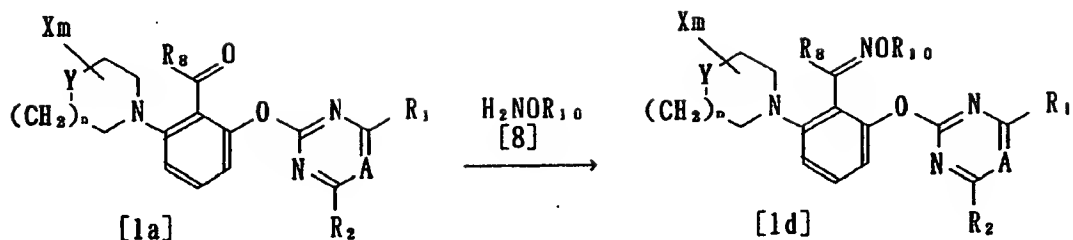
一般式〔6〕（式中、R₄、L₂、X、Y、m、nは前記と同じ意味を表す。）の化合物と一般式〔7〕（式中、R₁、R₂、L₃、Aは前記と同じ意味を表す。）の化合物を有機溶媒中で塩基の存在下カップリングさせ、一般式〔1a〕（式中、R₁、R₂、R₄、A、X、Y、m、nは前記と同じ意味を表す。）の化合物を製造することが出来る。塩基としては、水素化ナトリウム等の水素化金属類、炭酸カリウム等の炭酸塩類、トリエチルアミン等の有機塩基類であり、溶媒としては、DMF、DMSO、THF、DME等が挙げられる。反応混合物は反応が完了するまで、0～90℃で撹拌される。

(製造法-2)



一般式 [1a] (式中、 R_1 、 R_2 、 R_8 、 A 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。) の化合物を常法に従い、ナトリウムボロハイドライドで還元することによって、アルコールである一般式 [1b] (式中、 R_1 、 R_2 、 R_8 、 A 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。) の化合物を製造することが出来る。又、一般式 [1b] (式中、 R_1 、 R_2 、 R_8 、 A 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。) の化合物は、常法に従い、例えば、"Protective Groups in Organic Synthesis" T. W. Greene 編集、JOHN WILEY & SONS, N. Y. 発行記載の方法で一般式 [1c] (式中、 R_1 、 R_2 、 R_8 、 R_9 、 A 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。) の化合物へ誘導することが出来る。

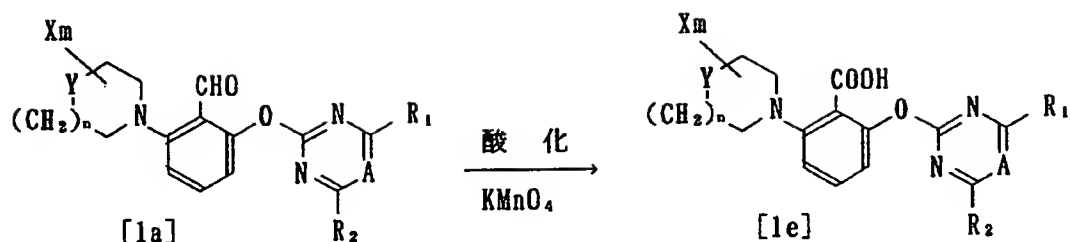
(製造法-3)



一般式 [1a] (式中、 R_1 、 R_2 、 R_8 、 A 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。) の化合物を、常法に従い、例えば、"Protective Groups in Organic Synthesis" T. W. Greene 編集、JOHN WILEY & SONS, N. Y. 発行記載の方法で、一般式 [8] (式中、 R_{10} は前記と同じ意味を表す。) で表されるアルコキシアミン類と有機溶媒中で塩基の存在下カップリングさせ、一般式 [1d] (式中、 R_1 、 R_2 、 R_8 、 R_{10} 、 A 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。) の化合物を製造することが出来る。

反応に使用される塩基としては、水素化ナトリウム等の水素化金属類、炭酸カリウム等の炭酸塩類、トリエチルアミン等の有機塩基類であり、溶媒としては、DMF、DMSO、THF、DME 等が挙げられる。反応混合物は反応が完了するまで、0～90℃で攪拌される。

(製造法 - 4)



一般式 [1a] (式中、 R_1 、 R_2 、 A 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。) の化合物を、常法に従い、例えば、過マンガン酸カリウム等の酸化剤を用いて酸化し、一般式 [1e] (式中、 R_1 、 R_2 、 R_8 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。) の化合物を製造することが出来る。

得られた一般式 [1e] (式中、 R_1 、 R_2 、 R_8 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。) の化合物は、常法に従い、カルボニルジイミダゾールと反応させ、活性アシル化体である一般式 [1f] (式中、 R_1 、 R_2 、 A 、 X 、 Y 、 W 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。) の化合物へ導くことが出来る。

次いで、得られた一般式 [1f] (式中、 R_1 、 R_2 、 A 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。) の化合物は、アルコール類又はアミン類と反応させて一般式 [1g] (式中、 R_1 、 R_2 、 R_7 、 A 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。) の化合物及び一般式 [1h] (式中、 R_1 、 R_2 、 R_{16} 、 R_{17} 、 A 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。) の化合物を製造することが出来る。

また、一般式 [1e] (式中、 R_1 、 R_2 、 A 、 X 、 Y 、 m 、 n は前記と同じ意味を表す。) で表される安息香酸誘導体の塩として、リチウム、ナトリウム、カリウムなどのアルカリ金属、カルシウム、マグネシウムなどのアルカリ土類金属、アンモニウム塩等が挙げられるが、これらの塩は慣用の方法で製造し得る。

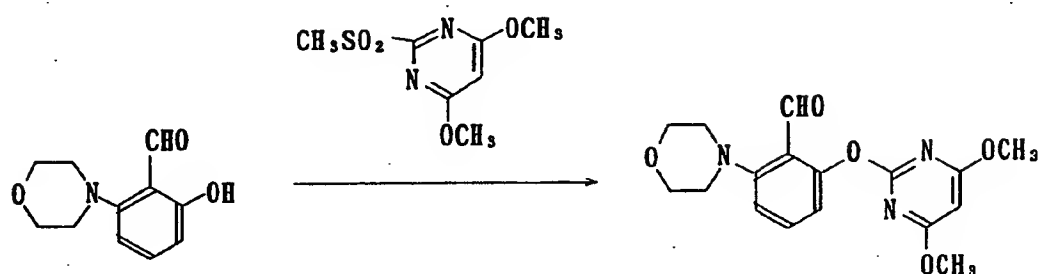
本発明化合物の構造は、IR、NMR、MS等から決定した。

【実施例】

以下に実施例をあげ、本発明を更に詳細に説明する。

【実施例 1】

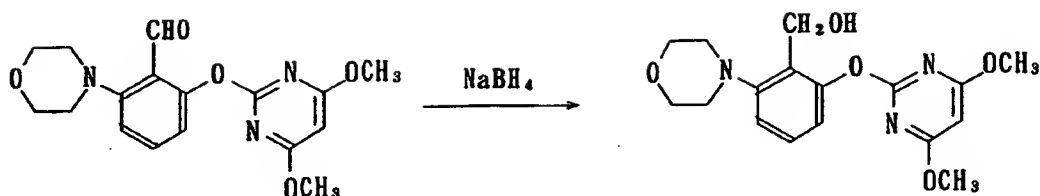
2-(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジルオキシ)-6-モルホリノベンズアルデヒド(化合物番号1-14)の合成



6-モルホリノサリチルアルデヒド 3.28 g、4,6-ジメトキシ-2-メチルスルホニルピリミジン 3.44 g、および炭酸カリウム 4.36 gのDMF混合液(50 ml)を60℃で16時間攪拌した。反応終了後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧下留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出液ヘキサン：酢酸エチル=2:1)で精製して、黄色結晶の目的物 3.2 gを得た。

【実施例 2】

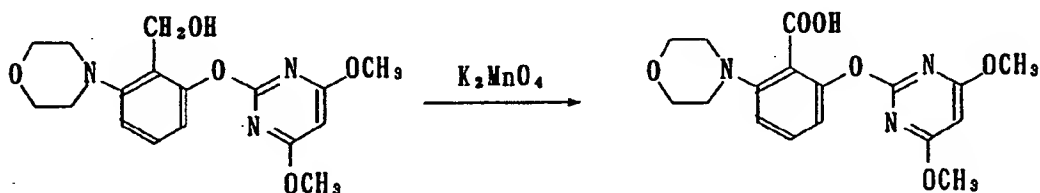
2-(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジルオキシ)-6-モルホリノベンジルアルコール(化合物番号1-24)の合成



2-(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジルオキシ)-6-モルホリノベンズアルデヒド 0.4 g の THF (5 ml) 溶液に、0℃で水素化ホウ素ナトリウム 0.022 g の水溶液 (0.5 ml) を滴下した。同温度で1時間攪拌後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧下留去した。得られた残留物をヘキサンで処理することにより目的物の結晶、0.36 g を得た。

[実施例 3]

2-(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジルオキシ)-6-モルホリノ安息香酸
(化合物番号 1-4) の合成

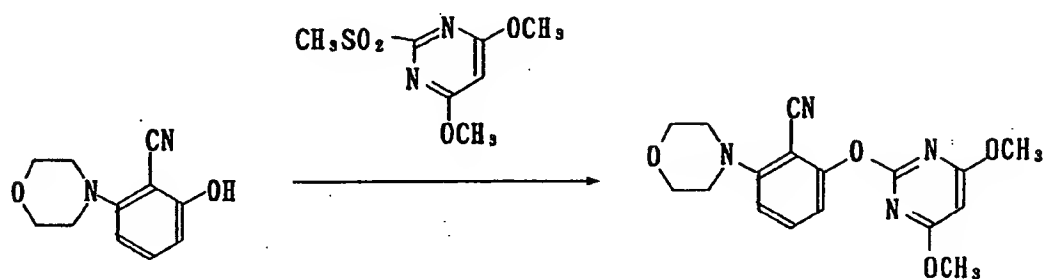


2-(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジルオキシ)-6-モルホリノベンズアルデヒド 1.93 g のアセトン (40 ml) 溶液に、室温で過マンガン酸カリウム 0.883 g の水溶液 (20 ml) を滴下した。滴下後、室温で20時間攪拌した。反応液を濾過助剤(セライト)で濾過し、得られた水溶液をエーテルで抽出し、未反応の原料を除いた。水層を塩酸で pH 3 に調整し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥

し、溶媒を減圧下留去した。得られた残留物をエーテル処理することにより淡黄色結晶の目的物 0.15 g を得た。

〔実施例 4〕

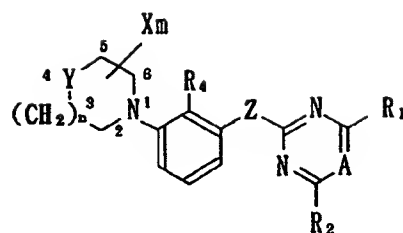
2-(4,6-ジメトキシ-2-ピリミジルオキシ)-6-モルホリノベンゾニトリル(化合物番号1-34)の合成



2-ヒドロキシ-6-モルホリノベンゾニトリル 0.12 g、4,6-ジメトキシ-2-メタンスルホニルピリミジン 0.128 g、および炭酸カリウム 0.162 g の DMF 混合液 (3 ml) を 80 °C で 16 時間攪拌した。反応後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧下留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン：酢酸エチル=2：1)で精製して、目的物の結晶 0.06 g を得た。

以上の実施例を含め、本発明の化合物の具体例を以下の表1、表2および表3に示す。

第 1 表



*a 物性値は融点、もしくは屈折率

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X _m	Y	n	A	Z	物性値 *a
1-1	OMe	OMe	H	COOH	H	CH ₂	0	CR ₃	O	
1-2	OMe	OMe	H	COOH	H	CH ₂	1	CR ₃	O	
1-3	OMe	OMe	H	COOH	H	CH ₂	2	CR ₃	O	
1-4	OMe	OMe	H	COOH	H	S	1	CR ₃	O	171-172
1-5	OMe	OMe	H	COOH	H	S	1	CR ₃	S	152-154
1-6	OMe	OMe	H	COOH	H	SO	1	CR ₃	O	
1-7	OMe	OMe	H	COOH	H	SO ₂	1	CR ₃	O	
1-8	OMe	OMe	H	COOH	H	NH	1	CR ₃	O	
1-9	OMe	OMe	H	COOH	H	CO	1	CR ₃	O	146-148
1-10	OMe	OMe	H	COOH	H	O	1	N	O	165-168
1-11	OMe	OMe	H	COOH	H	O	1	CR ₃	O	172-174
1-12	OMe	Me	H	COOH	H	O	1	CR ₃	O	134-137
1-13	OPr ⁱ	OPr ⁱ	H	COOH	H	O	1	CR ₃	O	137-139
1-14	Me	Me	H	COOH	H	O	1	CR ₃	O	150-151
1-15	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -		COOH	H	O	1	CR ₃	O	182-185
1-16	OBt	OBt	H	COOH	H	O	1	CR ₃	O	128-130
1-17	OPr	OPr	H	COOH	H	O	1	CR ₃	O	89-90

第 1 表 (続き)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X _m	Y	n	A	Z	物性値 †a
1-18	OMe	OE _t	H	COOH	H	O	1	CR ₃	O	141-144
1-19	OMe	OMe	H	COOH	H	S	1	CR ₃	O	163-165
1-20	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	COOH		H	O	1	CR ₃	O	104-105
1-21	OMe	OMe	H	COOH	H	O	1	CR ₃	S	139-142
1-22	OMe	OMe	H	COOH	3-Me, 5-Me	O	1	CR ₃	O	140-141
1-23	OMe	OMe		COOH	H	CH ₂	1	N	O	
1-24	OMe	OMe		COOH	H	O	1	N	O	
1-25	OMe	OMe	H	COOH	H	O	0	CR ₃	O	114-117
1-26	OMe	OMe	H	COOH	H	C=NOMe	0	CR ₃	O	149-152
1-27	OMe	OMe	H	CHO	H	CH ₂	0	CR ₃	O	
1-28	OMe	OMe	H	CHO	H	CH ₂	1	CR ₃	O	
1-29	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -	CHO		H	CH ₂	1	CR ₃	O	
1-30	OMe	OMe	H	CHO	H	CH ₂	2	CR ₃	O	
1-31	OMe	OMe	H	CHO	H	O	1	CR ₃	O	108-110
1-32	OMe	OMe	H	CHO	H	S	1	CR ₃	O	
1-33	OMe	OMe	H	CHO	H	SO	1	CR ₃	O	
1-34	OMe	OMe	H	CHO	H	SO ₂	1	CR ₃	O	
1-35	OMe	OMe	H	CHO	H	NH	1	CR ₃	O	
1-36	OMe	OMe	H	CHO	H	CO	1	CR ₃	O	
1-37	OMe	OMe	H	CHO	3-Me, 5-Me	O	1	CR ₃	O	
1-38	OMe	OPr ⁱ	H	CHO	H	CH ₂	0	CR ₃	O	

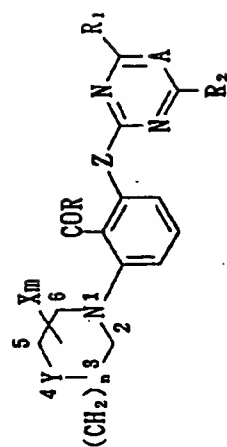
第 1 表 (続き)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X _m	Y	n	A	Z	物性値 $\pm a$
1-39	OMe	OPr ¹	H	CHO	H	CH ₂	1	CR ₃	O	
1-40	OMe	OMe		CHO	H	CH ₂	1	N	O	
1-41	OMe	OMe		CHO	H	O	1	N	O	
1-42	OMe	OMe	H	CHO	H	CH ₂	1	CR ₃	O	
1-43	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	H	CH ₂	1	CR ₃	O	
1-44	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	H	CH ₂	0	CR ₃	O	
1-45	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	H	CH ₂	1	CR ₃	O	
1-46	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	H	CH ₂	2	CR ₃	O	
1-47	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	H	O	1	CR ₃	O	174-177
1-48	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	H	S	1	CR ₃	O	
1-49	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	H	SO	1	CR ₃	O	
1-50	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	H	SO ₂	1	CR ₃	O	
1-51	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	H	NH	1	CR ₃	O	
1-52	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	H	CO	1	CR ₃	O	
1-53	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	Me, 5-Me	O	1	CR ₃	O	
1-54	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	H	CH ₂	0	CR ₃	O	
1-55	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	H	CH ₂	1	CR ₃	O	
1-56	OMe	OMe		CH ₂ OH	H	CH ₂	1	N	O	
1-57	OMe	OMe		CH ₂ OH	H	O	1	N	O	
1-58	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	H	CH ₂	1	CR ₃	S	
1-59	OMe	OMe	H	CH ₂ OH	H	O	1	CR ₃	S	
1-60	OMe	OMe	H	CN	H	CH ₂	0	CR ₃	O	
1-61	OMe	OMe	H	CN	H	CH ₂	1	CR ₃	O	
1-62	OMe	OMe	H	CN	H	CH ₂	2	CR ₃	O	
1-63	OMe	OMe	H	CN	H	O	1	CR ₃	O	128-130

第 1 表 (続き)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X _m	Y	n	A	Z	物性値 #a
1-64	OMe	OMe	H	CN	H	S	1	CR ₃	O	
1-65	OMe	OMe	H	CN	H	SO	1	CR ₃	O	
1-66	OMe	OMe	H	CN	H	SO ₂	1	CR ₃	O	
1-67	OMe	OMe	H	CN	H	NH	1	CR ₃	O	
1-68	OMe	OMe	H	CN	H	CO	1	CR ₃	O	
1-69	OMe	OMe	H	CN	3-Me, 5-Me	O	1	CR ₃	O	
1-70	OMe	OPr ¹	H	CN	H	CH ₂	0	CR ₃	O	
1-71	OMe	OPr ¹	H	CN	H	CH ₂	1	CR ₃	O	
1-72	OMe	OMe	H	CONH ₂	H	CH ₂	0	CR ₃	O	
1-73	OMe	OMe	H	CONH ₂	H	CH ₂	1	CR ₃	O	
1-74	OMe	OMe	H	CONH ₂	H	CH ₂	2	CR ₃	O	
1-75	OMe	OMe	H	CONH ₂	H	O	1	CR ₃	O	
1-76	OMe	OMe	H	CONH ₂	H	S	1	CR ₃	O	
1-77	OMe	OMe	H	CONH ₂	H	SO	1	CR ₃	O	
1-78	OMe	OMe	H	CONH ₂	H	SO ₂	1	CR ₃	O	
1-79	OMe	OMe	H	CONH ₂	H	NH	1	N	O	
1-80	OMe	OMe	H	CONH ₂	H	CO	1	N	O	
1-81	OMe	OPr ¹	H	CONH ₂	3-Me, 5-Me	O	1	CR ₃	O	
1-82	OMe	OPr ¹	H	CONH ₂	O	CH ₂	0	CR ₃	O	
1-83	OMe	OMe	H	CONH ₂	O	CH ₂	1	CR ₃	O	
1-84	OMe	OMe		CONH ₂	H	O	1	N	O	
1-85	OMe	OMe		CONH ₂	H	CH ₂	1	N	O	
1-86	OMe	OMe	H	CONH ₂	H	CH ₂	1	CR ₃	S	
1-87	OMe	OMe	H	COOH	H	O	1	CR ₃	S	

第 2 表



*a 物性値は融点、もしくは屈折率

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	Y	n	A	Z	物性値 *a
2-01	OMe	OMe	H	Me	H	0	1	CR ₃	0	
2-02	OMe	OMe	H	Et	H	0	1	CR ₃	0	
2-03	OMe	OMe	H	Bn	H	0	1	CR ₃	0	
2-04	OMe	OMe	H	CH ₂ Ph-4-Cl	H	0	1	CR ₄	0	
2-05	OMe	OMe	H	imidazolyl	H	0	1	CR ₃	0	154-156
2-06	OMe	OMe	H	morpholino	H	0	1	CR ₃	0	
2-07	OMe	OMe	H	piperidino	H	0	1	CR ₃	0	
2-08	OMe	OMe	H	pyrrolidinyl	H	0	1	CR ₃	0	
2-09	OMe	OMe	H	N(CH ₃) ₂	H	0	1	CR ₃	0	112-113
2-10	OMe	OMe	H	N(OMe)SO ₂ Me	H	0	1	CR ₃	0	

第 2 表 (つづき)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	Y	n	A	Z	物性値 *a
2-11	OMe	OMe	H	N=C(Me)N(Me) ₂	H	0	1	CR ₃	0	
2-12	OMe	OMe	H	NHCH ₂ CH ₂ OMe	H	0	1	CR ₃	0	
2-13	OMe	OMe	H	NHCOMe	H	0	1	CR ₃	0	
2-14	OMe	OMe	H	NHCONH ₂	H	0	1	CR ₃	0	
2-15	OMe	OMe	H	NHCOOMe	H	0	1	CR ₃	0	
2-16	OMe	OMe	H	NHNH ₂	H	0	1	CR ₃	0	
2-17	OMe	OMe	H	NHOCH ₂ CH=CH ₂	H	0	1	CR ₃	0	
2-18	OMe	OMe	H	NHOCH ₂ COOMe	H	0	1	CR ₃	0	
2-19	OMe	OMe	H	NHOH	H	0	1	CR ₃	0	
2-20	OMe	OMe	H	NHOMe	H	0	1	CR ₃	0	
2-21	OMe	OMe	H	NHPh	H	0	1	CR ₃	0	
2-22	OMe	OMe	H	NHSO ₂ CF ₃	H	0	1	CR ₃	0	86-88
2-23	OMe	OMe	H	NHSO ₂ CH ₃	H	0	1	CR ₃	0	189
2-24	OMe	OMe	H	NHSO ₂ Ph	H	0	1	CR ₃	0	63-66
2-25	OMe	OMe	H	NHSO ₂ Ph-4-Cl	H	0	1	CR ₃	0	
2-26	OMe	OMe	H	NMe(OMe)	H	0	1	CR ₃	0	
2-27	OMe	OMe	H	O(CH ₂ CH ₂ O) ₂ CH ₃	H	0	1	CR ₃	0	81-83
2-28	OMe	OMe	H	O-N=C(C ₂ H ₅) ₂	H	0	1	CR ₃	0	115-116
2-29	OMe	OMe	H	O-N=C(CH ₃)(CH ₂) ₃ CH ₃	H	0	1	CR ₃	0	1.5145(23)

第 2 表 (つづき)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	Y	n	A	Z	物性値 *a
2-30	OMe	OMe	H	O-N=C(CH ₃)C ₂ H ₅	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-31	OMe	OMe	H	O-N=C(CH ₃)Ph	H	0	1	CR ₃	0	54-57
2-32	OMe	OMe	H	O-N=C(Pr-i) ₂	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-33	OMe	OMe	H	O-N=CHPh	H	0	1	CR ₃	0	137-138
2-34	OMe	OMe	H	OBn	H	0	1	CR ₃	0	77-79
2-35	OMe	OMe	H	OBn	H	0	1	N	0	105-106
2-36	OMe	Me	H	OBn	H	0	1	CR ₃	0	82-84
2-37	OPr-i	OPr-i	H	OBn	H	0	1	CR ₃	0	103-105
2-38	Me	Me	H	OBn	H	0	1	CR ₃	0	68-71
2-39	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -	H	OBn	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-40	OMe	OMe	H	OBu-i	H	0	1	CR ₃	0	
2-41	OMe	OMe	H	OBu-n	H	0	1	CR ₃	0	
2-42	OMe	OMe	H	OBu-s	H	0	1	CR ₃	0	
2-43	OMe	OMe	H	OBu-t	H	0	1	CR ₃	0	
2-44	OMe	OMe	H	OCH(Bu-i)OCOCOC ₂ H ₅	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-45	OMe	OMe	H	OCH(CH ₃)OCOCBu-t	H	0	1	CR ₃	0	125-127
2-46	OMe	OMe	H	OCH(CH ₃)OCOCN(C ₂ H ₅) ₂	H	0	1	CR ₃	0	114-117
2-47	OMe	OMe	H	OCH(CH ₃)OCOCOC ₂ H ₅	H	0	1	CR ₃	0	115-116
2-48	OMe	OMe	H	OCH(CH ₃)OCOCOC ₂ H ₅	H	0	1	CR ₃	0	93-95
2-49	OMe	OMe	H	OCH(CH ₃)OCOCOC ₂ H ₅	H	0	1	CR ₃	0	81-83

第 2 表 (つづき)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	Y	n	A	Z	物性値 *a
2-50	OMe	OMe	H	OCH(CH ₃)Ph	H	0	1	CR ₃	0	82-84
2-51	OMe	OMe	H	OCH(Me)COOMe	H	0	1	CR ₆	0	91-93
2-52	OMe	OMe	H	OCH(Me)OCOOEt	H	0	1	CR ₄	0	
2-53	OMe	OMe	H	OCH(Me)OCOPr-i	H	0	1	CR ₇	0	
2-54	OMe	OMe	H	OCH ₂ (CF ₃ CF ₂) ₂ H	H	0	1	CR ₃	0	83-85
2-55	OMe	OMe	H	OCH ₂ CCH	H	0	1	CR ₇	0	116-118
2-56	OMe	OMe	H	OCH ₂ CH=CH ₂	H	0	1	CR ₇	0	70-72
2-57	OMe	OMe	H	OCH ₂ CH ₂ Br	H	0	1	CR ₃	0	102-104
2-58	OMe	OMe	H	OCH ₂ CH ₂ Cl	H	0	1	CR ₃	0	118-120
2-59	OMe	OMe	H	OCH ₂ CH ₂ I	H	0	1	CR ₃	0	97-99
2-60	OMe	OMe	H	OCH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	H	0	1	CR ₃	0	83-85
2-61	OMe	OMe	H	OCH ₂ CH ₂ N(Me) ₂	H	0	1	CR ₃	0	
2-62	OMe	OMe	H	OCH ₂ CH ₂ OPh	H	0	1	CR ₃	0	1.5500(24)
2-63	OMe	OMe	H	OCH ₂ CH ₂ Ph	H	0	1	CR ₃	0	105-107
2-64	OMe	OMe	H	OCH ₂ CH ₂ SOCH ₃	H	0	1	CR ₃	0	50-52
2-65	OMe	OMe	H	OCH ₂ CH ₂ Si(Me) ₃	H	0	1	CR ₃	0	1.528(26)
2-66	OMe	OMe	H	OCH ₂ Cl	H	0	1	CR ₃	0	75-77
2-67	OMe	OMe	H	OCH ₂ CN	H	0	1	CR ₃	0	
2-68	OMe	OMe	H	OCH ₂ CON(CH ₃)Ph	H	0	1	CR ₃	0	123
2-69	OMe	OMe	H	OCH ₂ COOBn	H	0	1	CR ₃	0	gum

第 2 表 (つづき)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	X _m	Y	n	A	Z	物性値 *a
2-70	OMe	OMe	H	OCH ₂ COOBu-t	H	H	0	1	CR ₇	0	
2-71	OMe	OMe	H	OCH ₂ COOH	H	H	0	1	CR ₃	0	167-169
2-72	OMe	OMe	H	OCH ₂ COOMe	H	H	0	1	CR ₇	0	94-97
2-73	OMe	OMe	H	OCH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	H	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-74	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	H	0	1	CR ₃	0	98-100
2-75	Me	Me	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	H	0	1	CR ₃	0	84-86
2-76	OMe	Me	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	H	0	1	CR ₃	0	90-91
2-77	OPr-i	OPr-i	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	H	0	1	CR ₃	0	88-90
2-78	CF ₃	-OCH ₂ CH ₂ -		OCH ₂ OCOBu-t	H	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-79	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	3-CH ₃ , 5-CH ₃	0	1	CR ₃	0	1.5045(24)
2-80	OBt	OBt	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	H	0	1	CR ₃	0	76-79
2-81	OPr	OPr	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	H	0	1	CR ₃	0	1.5040(23)
2-82	Me	OBt	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	H	0	1	CR ₃	0	1.5149(21)
2-83	Me	OPr	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	H	0	1	CR ₃	0	1.5118(21)
2-84	Me	NMe ₂	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-85	Me	NEt ₂	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-86	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	H	0	1	CR ₃	0	81-82
2-87	Me	OC ₂ H ₄ OMe	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	H	0	1	CR ₃	0	104-106
2-88	Et	OMe	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	H	0	1	CR ₃	0	1.5220(24)
2-89	OMe	-OCH ₂ CH ₂ -		OCH ₂ OCOBu-t	H	H	0	1	CR ₃	0	powder

第 2 表 (続き)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	Y	n	A	Z	物性値 *a
2-90	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	S	1	CR ₃	0	1.5158(23.5)
2-91	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	0	1	CR ₃	S	92-94
2-92	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOBu-t	H	S	1	CR ₃	S	81-84
2-93	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(C ₂ H ₅) ₂ Ph(4-Cl)	H	0	1	CR ₃	0	114-116
2-94	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(CH ₃) ₂ C ₂ H ₅	H	0	1	CR ₃	0	74-76
2-95	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(CH ₃) ₂ CH ₂ OPh	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-96	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	0	1	CR ₃	0	70-72
2-97	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-98	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ Ph	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-99	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(CH ₃) ₂ CH ₂ SPh	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-100	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(CH ₃) ₂ OPh	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-101	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(CH ₃) ₂ OPh(2-Cl)	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-102	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(CH ₃) ₂ Ph	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-103	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(CH ₃) ₂ Ph(2-Cl, 4-Cl)	H	0	1	CR ₃	0	153-154
2-104	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(CH ₃) ₂ Ph(4-OCCH ₃)	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-105	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(Cl) ₂ CH ₃	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-106	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(Ph) ₂ CH ₃	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-107	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC ₂ H ₅	H	0	1	CR ₃	0	117-119
2-108	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(CH ₃) ₂ Ph	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-109	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOC(CH ₃) ₂ Ph	H	0	1	CR ₃	0	gum

第 2 表 (つづき)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	Y	n	A	Z	物性値 *a
2-110	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOCH(OCH ₃)Ph	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-111	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOCH(Pr-i)Ph(4-Cl)	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-112	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOCH=CHCOOC ₂ H ₅	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-113	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOCH ₂ CH=CH ₂	H	0	1	CR ₃	0	88-90
2-114	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOCH ₃	H	0	1	CR ₃	0	136-138
2-115	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOCH ₃	H	0	1	CR ₃	0	83-85
2-116	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh	H	0	1	CR ₃	0	127-128
2-117	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-Bn)	H	0	1	CR ₃	0	68-70
2-118	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-CF ₃ , 6-CF ₃)	H	0	1	CR ₃	0	124-126
2-119	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-CF ₃)	H	0	1	CR ₃	0	80-82
2-120	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-CH ₃ , 6-CH ₃)	H	0	1	CR ₃	0	114-116
2-121	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-CH ₃ , 6-CH ₃)	H	0	1	CR ₃	0	73-75
2-122	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-CH ₃ , 6-CH ₃)	H	0	1	CR ₃	0	64-65
2-123	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-CH ₃ , 6-CH ₃)	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-124	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-CH ₃ , 6-CH ₃)	H	0	1	CR ₃	0	76-78
2-125	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-CH ₃)	H	0	1	CR ₃	0	136-138
2-126	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-Cl, 3-Cl, 6-Cl)	H	0	1	CR ₃	0	92-94
2-127	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-Cl, 4-Cl, 6-Cl)	H	0	1	CR ₃	0	130-131
2-128	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-Cl, 4-F)	H	0	1	CR ₃	0	118-121
2-129	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-Cl, 4-SCH ₃)	H	0	1	CR ₃	0	120-121

第 2 表 (つづき)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	Y	n	A	Z	物性値 *a
2-130	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-Cl, 6-Cl)	H	0	1	CR ₃	0	139-141
2-131	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-Cl, 6-F)	H	0	1	CR ₃	0	99-100
2-132	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-Cl)	H	0	1	CR ₃	0	109-111
2-133	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-OOBn)	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-134	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-F, 6-F)	H	0	1	CR ₃	0	121-123
2-135	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-Me, 4-Me, 6-Me)	H	0	1	CR ₃	0	95-97
2-136	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-OBn, 6-OBn)	H	0	1	CR ₃	0	142-144
2-137	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-OC ₂ H ₅ , 6-OC ₂ H ₅)	H	0	1	CR ₃	0	68-70
2-138	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-OC ₄ H ₉ , 6-OC ₄ H ₉)	H	0	1	CR ₃	0	1.5792(25)
2-139	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-OCOCH ₃)	H	0	1	CR ₃	0	138-140
2-140	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-OH, 6-OH)	H	0	1	CR ₃	0	120-122
2-141	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-OMe, 6-OMe)	H	0	1	CR ₃	0	146-147
2-142	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-OPr-i, 6-OPr-i)	H	0	1	CR ₃	0	1.5230(23)
2-143	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-Ph)	H	0	1	CR ₃	0	74-76
2-144	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(2-Pr-i)	H	0	1	CR ₃	0	89-90
2-145	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(3-NH ₂)	H	0	1	CR ₃	0	129-131
2-146	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(3-NHCOCH ₃)	H	0	1	CR ₃	0	66-68
2-147	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(4-Bu-t)	H	0	1	CR ₃	0	113-115
2-148	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(4-NH ₂)	H	0	1	CR ₃	0	167-169
2-149	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(4-NHCOCH ₃)	H	0	1	CR ₃	0	178-180

第 2 表 (つづき)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	Y	n	A	Z	物性値 *a
2-150	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(4-NHCONHC ₂ H ₅)	H	0	1	CR ₃	0	66-70
2-151	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(4-NHCOOC ₂ H ₅)	H	0	1	CR ₃	0	133-135
2-152	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(4-NMe ₂)	H	0	1	CR ₃	0	151-153
2-153	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(4-OCH ₃)	H	0	1	CR ₃	0	125-126
2-154	OMe	OMe	H	OCH ₂ OCOPh(4-Ph)	H	0	1	CR ₃	0	166-168
2-155	OMe	OMe	H	OCH ₂ OMe	H	0	1	CR ₇	0	
2-156	OMe	OMe	H	OCH ₂ Ph-4-Cl	H	0	1	CR ₃	0	
2-157	OMe	OMe	H	OCH ₂ SCH ₃	H	0	1	CR ₃	0	1.5606(25)
2-158	OMe	OMe	H	OCH ₂ SPh	H	0	1	CR ₃	0	97-99
2-159	OMe	OMe	H	OCH ₂ SP ^r -n	H	0	1	CR ₃	0	107-109
2-160	OMe	OMe	H	OBt	H	0	1	CR ₃	0	117-118
2-161	OMe	OMe	H	OH _{ex} -c	H	0	1	CR ₃	0	
2-162	OMe	OMe	H	OH _{ex} -n	H	0	1	CR ₃	0	
2-163	OMe	OMe	H	OMe	H	0	1	CR ₃	0	135-136
2-164	OMe	OMe	H	OMe	H	CH ₂	0	CR ₃	0	
2-165	OMe	OMe	H	OMe	H	CH ₂	1	CR ₃	0	
2-166	OMe	OMe	H	OMe	H	CH ₂	2	CR ₃	0	
2-167	OMe	OMe	H	OMe	H	S	1	CR ₃	0	
2-168	OMe	OMe	H	OMe	H	SO	1	CR ₃	0	

第 2 表 (つづき)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	Y	n	A	Z	物性値 *a
2-169	OMe	OMe	H	OMe	H	SO ₂	1	CR ₃	0	
2-170	OMe	OMe	H	OMe	H	NH	1	CR ₃	0	
2-171	OMe	OMe	H	OMe	H	NHCO	1	CR ₃	0	
2-172	OMe	OMe	H	OMe	H	0	1	N	0	
2-173	OMe	OMe	H	OMe	H	0	1	CR ₃	S	
2-174	OMe	OMe	H	ON(Bn) ₂	H	0	1	CR ₃	0	
2-175	OMe	OMe	H	ON(Me) ₂	H	0	1	CR ₃	0	
2-176	OMe	OMe	H	ON(Me)Bn	H	0	1	CR ₃	0	
2-177	OMe	OMe	H	ON=C(Me) ₂	H	0	1	CR ₃	0	98-101
2-178	OMe	OMe	H	ON=C(Pr-n) ₂	H	0	1	CR ₃	0	
2-179	OMe	OMe	H	ONa	H	0	1	CR ₃	0	
2-180	OMe	OMe	H	ONH ₂	H	0	1	CR ₃	0	
2-181	OMe	OMe	H	ONHBt	H	0	1	CR ₃	0	
2-182	OMe	OMe	H	ONHHex-c	H	0	1	CR ₃	0	
2-183	OMe	OMe	H	ONHMe	H	0	1	CR ₃	0	
2-184	OMe	OMe	H	OPh	H	0	1	CR ₃	0	
2-185	OMe	OMe	H	OPr-i	H	0	1	CR ₃	0	123-124
2-186	OMe	OMe	H	OPr-n	H	0	1	CR ₃	0	98-100
2-187	OMe	OMe	H	Ph	H	0	1	CR ₃	0	
2-188	OMe	OMe	H	SBn	H	0	1	CR ₃	0	

第 2 表 (つづき)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	Y	n	A	Z	物性値 *a
2-189	OMe	OMe	H	SCH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	0	1	CR ₃	0	99-101
2-190	OMe	OMe	H	SBt	H	0	1	CR ₃	0	74-76
2-191	OMe	OMe	H	ON(C ₄ H ₉), Bn	H	0	1	CR ₃	0	180(dec)
2-192	OMe	OMe	H	ON(CH ₃) ₄	H	0	1	CR ₃	0	185(dec)
2-193	OMe	OMe	H	#1	H	0	1	CR ₃	0	109-111
2-194	OMe	OMe	H	#2	H	0	1	CR ₃	0	
2-195	OMe	OMe	H	#3	H	0	1	CR ₃	0	
2-196	OMe	OMe	H	#4	H	0	1	CR ₃	0	
2-197	OMe	OMe	H	#5	H	0	1	CR ₃	0	
2-198	OMe	OMe	H	#6	H	0	1	CR ₃	0	122-124
2-199	OMe	OMe	H	#7	H	0	1	CR ₃	0	69-70
2-200	OMe	OMe	H	#8	H	0	1	CR ₃	0	55-58
2-201	OMe	OMe	H	#9	H	0	1	CR ₃	0	52-54
2-202	OMe	OMe	H	#10	H	0	1	CR ₃	0	1.5422(25)
2-203	OMe	OMe	H	#10	H	0	1	CR ₃	S	gum
2-204	OMe	OMe	H	#11	H	0	1	CR ₃	0	114-116
2-205	OMe	OMe	H	#12	H	0	1	CR ₃	0	77-78
2-206	OMe	OMe	H	#13	H	0	1	CR ₃	0	88-89
2-207	OMe	OMe	H	#13	H	S	1	CR ₃	0	96-97

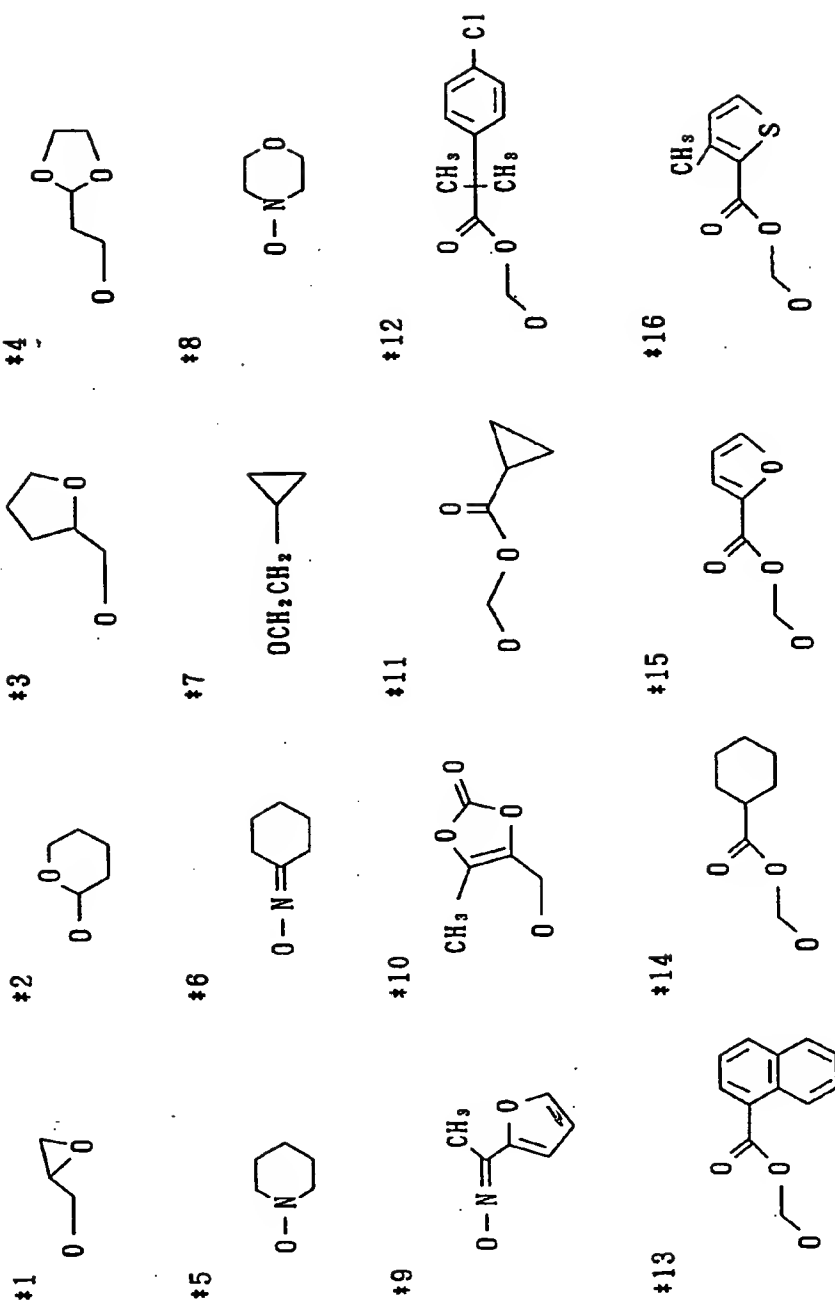
第 2 表 (つづき)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	Y	n	A	Z	物性値 *a
2-208	OMe	OMe	H	*14	H	0	1	CR ₃	0	78-80
2-209	OMe	OMe	H	*15	H	0	1	CR ₃	0	108-110
2-210	OMe	OMe	H	*16	H	0	1	CR ₃	0	120-121
2-211	OMe	OMe	H	*17	H	0	1	CR ₃	0	91-92
2-212	OMe	OMe	H	*18	H	0	1	CR ₃	0	73-75
2-213	OMe	OMe	H	*19	H	0	1	CR ₃	0	1.5835(32)
2-214	OMe	OMe	H	*20	H	0	1	CR ₃	0	80-82
2-215	OMe	OMe	H	*21	H	0	1	CR ₃	0	149-151
2-216	OMe	OMe	H	*22	H	0	1	CR ₃	0	54-55
2-217	OMe	OMe	H	*23	H	0	1	CR ₃	0	1.5337(23)
2-218	OMe	OMe	H	*24	H	0	1	CR ₃	0	108-110
2-219	OMe	OMe	H	*25	H	0	1	CR ₃	0	110-112
2-220	OMe	OMe	H	*26	H	0	1	CR ₃	0	138-140
2-221	OMe	OMe	H	*27	H	0	1	CR ₃	0	73-75
2-222	OMe	OMe	H	*28	H	0	1	CR ₃	0	118-120
2-223	OMe	OMe	H	*29	H	0	1	CR ₃	0	1.5832(27)
2-224	OMe	OMe	H	*30	H	0	1	CR ₃	0	115
2-225	OMe	OMe	H	*31	H	0	1	CR ₃	0	92-94

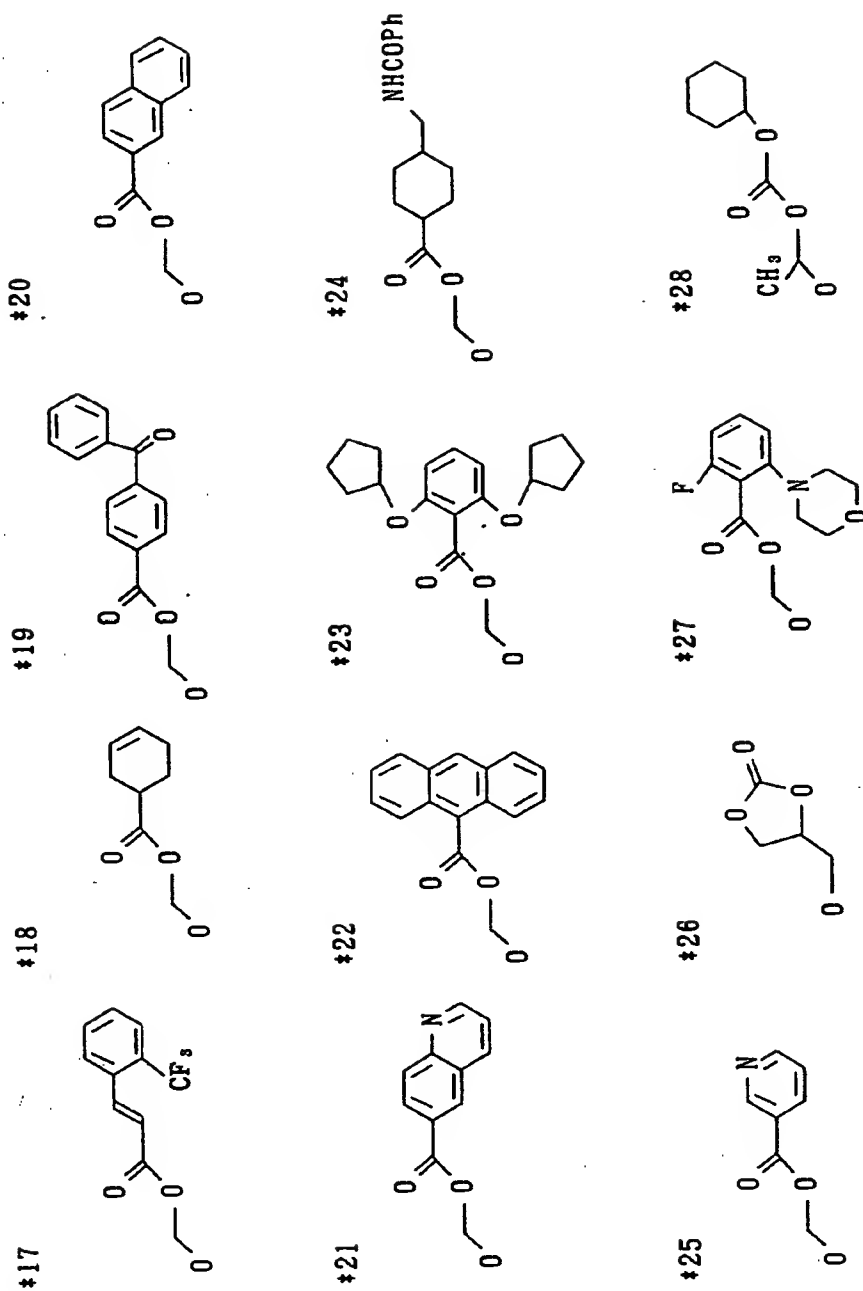
第 2 表 (つづき)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	Y	n	A	Z	物性値 *a
2-226	OMe	OMe	H	*32	H	0	1	CR ₃	0	88-90
2-227	OMe	OMe	H	*33	H	0	1	CR ₃	0	84-85
2-228	OMe	OMe	H	*34	H	0	1	CR ₃	0	gum
2-229	OMe	OMe	H	*35	H	0	1	CR ₃	0	57-59
2-230	OMe	OMe	H	*36	H	0	1	CR ₃	0	105-107
2-231	OMe	OMe	H	*37	H	0	1	CR ₃	0	183-185
2-232	OMe	OMe	H	*38	H	0	1	CR ₃	0	123-125
2-233	OMe	OMe	H	*39	H	0	1	CR ₃	0	78-79
2-234	OMe	OMe	H	*40	H	0	1	CR ₃	0	157-159
2-235	OMe	OMe	H	*41	H	0	1	CR ₃	0	38-40
2-236	OMe	OMe	H	*42	H	0	1	CR ₃	0	86-88

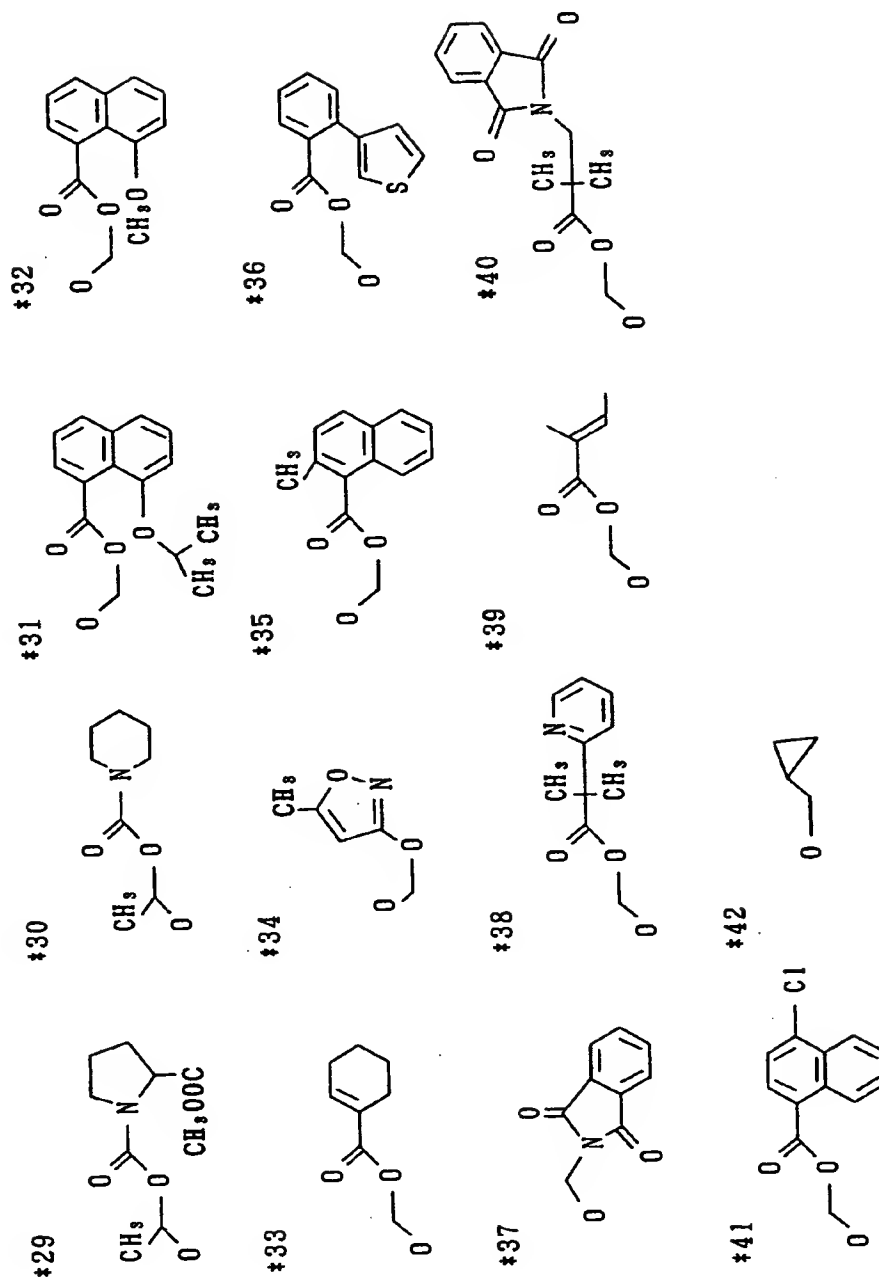
第 2 表 (つづき)



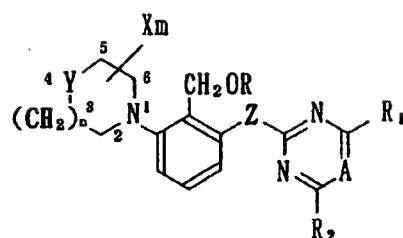
第 2 表 (つづき)



第 2 表 (つづき)



第 3 表



*a 物性値は融点、もしくは屈折率

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	Y	n	A	Z	物性値*a
3-1	OMe	OMe	H	COMe	H	O	1	CR3	O	
3-2	OMe	OMe	H	COBt	H	O	1	CR3	O	
3-3	OMe	OMe	H	COPr-n	H	O	1	CR3	O	
3-4	OMe	OMe	H	COPr-i	H	O	1	CR3	O	
3-5	OMe	OMe	H	COBu-n	H	O	1	CR3	O	
3-6	OMe	OMe	H	COBu-i	H	O	1	CR3	O	
3-7	OMe	OMe	H	COBu-s	H	O	1	CR3	O	
3-8	OMe	OMe	H	COBu-t	H	O	1	CR3	O	
3-9	OMe	OMe	H	COHex-n	H	O	1	CR3	O	
3-10	OMe	OMe	H	COHex-c	H	O	1	CR3	O	
3-11	OMe	OMe	H	COC ₈ H ₁₇	H	O	1	CR3	O	
3-12	OMe	OMe	H	COBn	H	O	1	CR3	O	
3-13	OMe	OMe	H	COCH ₂ Ph-4-Cl	H	O	1	CR3	O	
3-14	OMe	OMe	H	COCH ₂ Ph-4-OMe	H	O	1	CR3	O	
3-15	OMe	OMe	H	COCH ₂ Ph-4-Me	H	O	1	CR3	O	
3-16	OMe	OMe	H	COCH ₂ Ph-2-Cl-4-Cl	H	O	1	CR3	O	
3-17	OMe	OMe	H	COPh	H	O	1	CR3	O	
3-18	OMe	OMe	H	COPh-2-Cl	H	O	1	CR3	O	
3-19	OMe	OMe	H	COPh-4-Cl	H	O	1	CR3	O	

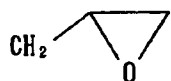
第 3 表 (続き)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	Y	n	A	Z	物性値 ^a
3-20	OMe	OMe	H	COPh-2-Cl-4-Cl	H	0	1	CR3	0	
3-21	OMe	OMe	H	COPh-2-Cl-6-Cl	H	0	1	CR3	0	
3-22	OMe	OMe	H	COPh-4-Me	H	0	1	CR3	0	
3-23	OMe	OMe	H	COPh-4-CF ₃	H	0	1	CR3	0	
3-24	OMe	OMe	H	COPh-4-NO ₂	H	0	1	CR3	0	
3-25	OMe	OMe	H	COPh-4-OMe	H	0	1	CR3	0	
3-26	OMe	OMe	H	COPh-4-F	H	0	1	CR3	0	
3-27	OMe	OMe	H	COPh-2-Me-6-Me	H	0	1	CR3	0	
3-28	OMe	OMe	H	COPh-2-Me-4-Cl	H	0	1	CR3	0	
3-29	OMe	OMe	H	CONHEt	H	0	1	CR3	0	
3-30	OMe	OMe	H	CONHPh	H	0	1	CR3	0	
3-31	OMe	OMe	H	CONHPh-3-Cl	H	0	1	CR3	0	
3-32	OMe	OMe	H	CONHPh-4-Br	H	0	1	CR3	0	
3-33	OMe	OMe	H	COOMe	H	0	1	CR3	0	
3-34	OMe	OMe	H	COOBu-t	H	0	1	CR3	0	
3-35	OMe	OMe	H	CSNHPh	H	0	1	CR3	0	
3-36	OMe	OMe	H	CSNHPh-4-Cl	H	0	1	CR3	0	
3-37	OMe	OMe	H	COCH ₂ Cl	H	0	1	CR3	0	
3-38	OMe	OMe	H	COCHCl ₂	H	0	1	CR3	0	
3-39	OMe	OMe	H	COCH ₂ OMe	H	0	1	CR3	0	
3-40	OMe	OMe	H	COCH ₂ SMe	H	0	1	CR3	0	
3-41	OMe	OMe	H	COCH ₂ SO ₂ Me	H	0	1	CR3	0	
3-42	OMe	OMe	H	SO ₂ Me	H	0	1	CR3	0	
3-43	OMe	OMe	H	SO ₂ Ph	H	0	1	CR3	0	
3-44	OMe	OMe	H	SO ₂ NHMe	H	0	1	CR3	0	
3-45	OMe	OMe	H	COCF ₃	H	0	1	CR3	0	
3-46	OMe	OMe	H	CONH ₂	H	0	1	CR3	0	
3-47	OMe	OMe	H	Me	H	0	1	CR3	0	
3-48	OMe	OMe	H	Et	H	0	1	CR3	0	
3-49	OMe	OMe	H	Pr-n	H	0	1	CR3	0	
3-50	OMe	OMe	H	Pr-i	H	0	1	CR3	0	

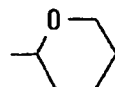
第 3 表 (続き)

No.	R ₁	R ₂	R ₃	R	X _m	Y	n	A	Z	物性値 ^a
3-51	OMe	OMe	H	Bu-n	H	0	1	CR3	0	
3-52	OMe	OMe	H	Bu-i	H	0	1	CR3	0	
3-53	OMe	OMe	H	Bu-s	H	0	1	CR3	0	
3-54	OMe	OMe	H	Bu-t	H	0	1	CR3	0	
3-55	OMe	OMe	H	Hex-n	H	0	1	CR3	0	
3-56	OMe	OMe	H	Hex-c	H	0	1	CR3	0	
3-57	OMe	OMe	H	CH ₂ OMe	H	0	1	CR3	0	
3-58	OMe	OMe	H	CH ₂ SMe	H	0	1	CR3	0	
3-59	OMe	OMe	H	CH ₂ SO ₂ Me	H	0	1	CR3	0	
3-60	OMe	OMe	H	CH ₂ CH ₂ OMe	H	0	1	CR3	0	
3-61	OMe	OMe	H	CH ₂ CN	H	0	1	CR3	0	
3-62	OMe	OMe	H	Bn	H	0	1	CR3	0	
3-63	OMe	OMe	H	CH ₂ Ph-4-Cl	H	0	1	CR3	0	
3-64	OMe	OMe	H	CH ₂ Ph-4-OMe	H	0	1	CR3	0	
3-65	OMe	OMe	H	CH ₂ Ph-4-Me	H	0	1	CR3	0	
3-66	OMe	OMe	H	CHO	H	0	1	CR3	0	
3-67	OMe	OMe	H	*1	H	0	1	CR3	0	
3-68	OMe	OMe	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	0	1	CR3	0	
3-69	OMe	OMe	H	CH ₂ CCH	H	0	1	CR3	S	
3-70	OMe	OMe	H	CH ₂ CH=CHCl	H	0	1	CR3	S	
3-71	OMe	OMe	H	*2	H	0	1	CR3	S	
3-72	OMe	OMe	H	CH ₂ COOMe	H	0	1	CR3	S	
3-73	OMe	OMe	H	CH(Me)COOMe	H	0	1	CR3	S	
3-74	OMe	OMe	H	COMe	H	0	1	CR3	S	
3-75	OMe	OMe		COMe	H	0	1	N	0	
3-76	OMe	OMe		COMe	H	0	1	N	S	

*1



*2



本発明化合物は畑作条件で、土壌処理、茎葉処理のいずれの方法でも高い除草活性を示し、アキノエノコログサ、イチビ、イヌビユ、オナモミ等の各種畑雑草に有効で、トウモロコシ、ムギ、大豆、ワタ等の作物に選択性を示す化合物も含まれている。

本発明化合物は、作物、観賞用植物、果樹等の有用植物に対し、生育抑制作用等の植物成長調節作用を有するものも含まれている。

また、本発明化合物は、ノビエ、タマガヤツリ、オモダカ、ホタルイ等の各種水田雑草に対し、優れた殺草効力を有し、イネに選択性を示す化合物も含まれている。

更に本発明化合物は果樹園、芝生、線路端、空き地等の雑草の防除にも適用することができる。

更にまた、本発明化合物の中間体化合物の中には除草活性を有するものも含まれる。

〔除草剤〕

本発明除草剤は、本発明化合物の1種又は2種以上を有効成分として含有する。本発明化合物を実際に施用する際には他成分を加えず純粋な形で使用できるし、また農薬として使用する目的で一般の農薬のとり得る形態、即ち、水和剤、粒剤、粉剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、フロアブル等の形態で使用することもできる。添加剤および担体としては固型剤を目的とする場合は、大豆粉、小麦粉等の植物性粉末、珪藻土、燐灰石、石こう、タルク、ベントナイト、パイロフィライト、クレイ等の鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝等の有機及び無機化合物が使用される。液体の剤型を目的とする場合は、ケロシン、キシレンおよびソルベントナフサ等の石油留分、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アルコール、アセトン、トリクロルエチレン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水等を溶剤として使用する。これらの製剤において均一かつ安定な形態をとるために、必要ならば界面活性剤を

添加することもできる。

本発明除草剤における有効成分濃度は前述した製剤の形により種々の濃度に変化するものであるが、例えば、水和剤に於いては、5～90%、好ましくは10～85%：乳剤に於いては、3～70%、好ましくは5～60%：粒剤に於いては、0.01～50%、好ましくは、0.05%～10%の濃度が用いられる。

このようにして得られた水和剤、乳剤は水で所定の濃度に希釈して懸濁液或いは乳濁液として、粒剤はそのまま雑草の発芽前又は発芽後に土壤に散布処理もしくは混和処理される。実際に本発明除草剤を適用するに当たっては1ヘクタール当たり有効成分0.1g以上の適当量が施用される。

又、本発明除草剤は公知の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、植物成長調整剤等と混合して使用することも出来る。特に、除草剤と混合使用することにより、使用薬量を減少させることが可能である。又、省力化をもたらすのみならず、混合薬剤の相乗作用により一層高い効果も期待できる。その場合、複数の公知除草剤との組合せも可能である。

本発明除草剤と混合使用するにふさわしい薬剤としては、ベンチオカーブ、モリネート、ジメピペレート等のカーバメイト系除草剤、チオカーバメイト系除草剤、ブタクロール、プレチラクロール、メフェナセット等の酸アミド系除草剤、クロメトキシニル、ピフェノックス等のジフェニルエーテル系除草剤、アトラジン、シアナジン等のトリアジン系除草剤、クロルスルフロン、スルホメチュロンメチル等のスルホニルウレア系除草剤、MCP、MCPB等のフェノキシアルカンカルボン酸系除草剤、ジクロホップメチル等のフェノキシフェノキシプロピオン酸系除草剤、フルアジホップブチル等のピリジルオキシフェノキシプロピオン酸系除草剤、トリフルラリン、ペンジメタリン等のジニトロアニリン系除草剤、リニュロン、ジウロン等のウレア系除草剤、ベンゾイルプロップエチル、フランプロップエチル等のベンゾイルアミノプロピオン酸系除草剤、イマザキン等のイミダゾリノン系除草剤、その他として、ピペロホス、ダイムロン、ベントゾン、ダイフェンゾコート、ナプロアニリド、エトベンザミド、トリアゾフェナミ

ド、キンクロラック、更に、セトキシジム、クレソジム等のシクロヘキサジオン系の除草剤等が挙げられる。又、これらの組み合わせた物に植物油及び油濃縮物を添加することも出来る。

【実施例】

〔除草剤〕

次に、本発明除草剤に関する製剤例を若干示すが、有効成分化合物、添加物及び添加割合は、本実施例にのみ限定されることなく、広い範囲で変更可能である。製剤実施例中の部は重量部を示す。

実施例 5 水和剤

本発明化合物	20部
ホワイトカーボン	20部
ケイソウ土	52部
アルキル硫酸ソーダ	8部

以上を均一に混合、微細に粉碎して、有効成分20%の水和剤を得た。

実施例 6 乳剤

本発明化合物	20部
キシレン	55部
ジメチルホルムアミド	15部
ポリオキシエチレンフェニルエーテル	10部

以上を混合、溶解して有効成分20%の乳剤を得た。

実施例 7 粒剤

本発明化合物	5部
タルク	40部

クレー	38部
ベントナイト	10部
アルキル硫酸ソーダ	7部

以上を均一に混合して微細に粉碎後、直径0.5～1.0mmの粒状に造粒して有効成分5%の粒剤を得た。

発明の効果：

次に本発明除草剤の効果に関する試験例を示す。

除草効果は下記の調査基準に従って調査し、殺草指数で表した。

調査基準

殺草率	殺草指数
0%	0
20～29%	2
40～49%	4
60～69%	6
80～89%	8
100%	10

また、1、3、5、7、9の数値は、各々0と2、2と4、4と6、6と8、8と10の中間の値を示す。

(無処理区の地上部生草重－処理区の地上部生草重)

$$\text{殺草率 (\%)} = \frac{\text{無処理区の地上部生草重} - \text{処理区の地上部生草重}}{\text{無処理区の地上部生草重}} \times 100$$

試験例1 茎葉散布処理

200cm²のポットに土壌を充填し、表層にアキノエノコログサ、イヌビユ

、イチビ、オナモミの各種子を播き、軽く覆土後温室内で生育させた。各雑草が5～10 cmの草丈に生育した時点で供試化合物の実施例6で示した乳剤の水希釈液を有効成分が63 g/h aになるように小型噴霧器にて雑草の茎葉部に散布した。3週間後に雑草の除草効果を調査し、その結果を第4表に示した。

第 4 表

化合物番号	薬 量 g/h a	アキノ エノコログサ	イチビ	イヌビユ	オナモミ
1- 11	63	10	10	10	10
2- 5	63	10	8	10	8
2-105	63	10	8	9	10
2-113	63	10	8	10	8
2-215	63	10	10	10	10
2-232	63	8	10	9	8
2-233	63	9	9	10	10
比較例 A	63	7	0	7	5

試験例2 畑土壌処理

表面積が250 cm²のプラスチックポットに畑土壌を充填し、これに雑草として、アキノエノコログサ、イチビ、イヌビユの種子を播種し、その上に0.5 cmの覆土をした。翌日実施例5に示した水和剤の希釈液を、その有効成分が63 g/h aとなるように覆土上に均一に散布し、処理20日後に除草効果を調査し、その結果を第5表に示した。

第 5 表

化合物番号	薬 g / h a	アキノ エノコログサ	イチビ	イヌビユ
1 - 1 0	6 3	1 0	8	1 0
1 - 1 1	6 3	1 0	8	1 0
2 - 5	6 3	9	8	9
2 - 2 8	6 3	1 0	1 0	1 0
2 - 7 4	6 3	9	8	9
2 - 9 7	6 3	8	8	9
2 - 9 9	6 3	8	8	9
2 - 1 0 4	6 3	9	8	9
2 - 1 1 0	6 3	8	8	9
2 - 1 2 3	6 3	8	8	9
2 - 1 4 5	6 3	8	8	8
2 - 1 4 9	6 3	1 0	1 0	1 0
2 - 1 5 2	6 3	1 0	1 0	1 0
2 - 1 5 4	6 3	9	8	8
2 - 1 5 7	6 3	1 0	1 0	9
2 - 1 7 7	6 3	8	8	8
2 - 1 9 1	6 3	8	8	8
2 - 2 0 8	6 3	8	8	1 0
2 - 2 0 9	6 3	8	8	8
2 - 2 1 0	6 3	9	8	1 0
2 - 2 1 2	6 3	8	8	9
比較例 A	6 3	6	6	8

試験例 3 水田茎葉処理

表面積が 100 cm^2 のポットに水田土壌を充填し、代掻後、ノビエ、ホタルイおよびオモダカの種子を播種したのち、2葉期のイネを移植した。これを温室内で生育させ、各雑草が1～1.5葉期になった時点で水深3 cmに湛水したのち、各供試化合物の実施例5で示した水和剤の希釈液を有効成分が 16 g/ha となるように滴下処理した。処理3週間後に除草効果およびイネの葉害の程度を調査し、結果を第6表に示した。

第 6 表

化合物番号	薬量 g/ha	ノビエ	オモダカ	ホタルイ	イネ
2-18	16	8	8	7	2
2-28	16	8	8	8	1
2-30	16	10	9	7	2
2-31	16	10	9	8	2
2-47	16	10	9	7	2
2-48	16	9	8	8	1
2-49	16	8	8	8	1
2-54	16	8	9	8	0
2-65	16	10	9	8	2
2-86	16	9	8	8	0
2-95	16	9	8	8	0
2-96	16	9	8	8	1
2-97	16	8	8	8	2
2-98	16	9	9	9	1
2-100	16	9	9	8	1
2-101	16	9	9	8	0

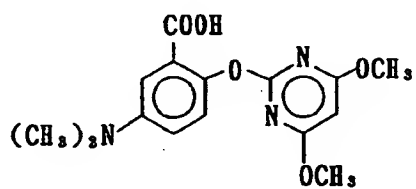
第 6 表 (続 き)

化合物番号	薬 量 g / h a	ノビエ	オモダカ	ホタルイ	イネ
2-102	16	10	9	8	2
2-108	16	9	8	8	1
2-109	16	9	8	8	0
2-110	16	8	8	8	2
2-121	16	8	9	8	2
2-123	16	8	9	8	2
2-130	16	10	9	7	0
2-131	16	9	9	8	2
2-133	16	8	8	8	0
2-139	16	8	8	8	2
2-144	16	10	8	7	0
2-149	16	10	8	8	2
2-151	16	9	8	8	2
2-198	16	8	9	7	2
2-201	16	8	8	8	2
2-205	16	10	8	8	0
2-206	16	10	8	8	1

第 6 表 (続 き)

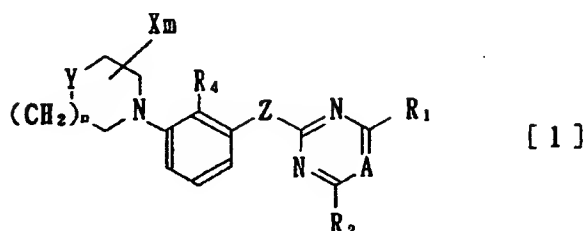
化合物番号	薬 量 g / h a	ノビエ	オモダカ	ホタルイ	イネ
2 - 2 1 0	1 6	1 0	9	8	2
2 - 2 1 1	1 6	1 0	9	7	2
2 - 2 1 6	1 6	8	8	7	1
2 - 2 2 1	1 6	9	9	7	1
2 - 2 2 2	1 6	9	8	8	2
2 - 2 3 3	1 6	9	9	7	2
比較例 A	1 6	6	8	5	2

比較例 A (特開平 1 - 9 3 5 7 6 号記載の化合物)



請 求 の 範 囲

1. 式〔I〕で表される化合物、またはその農園芸学上許容される塩。



〔式中、Aは窒素原子、もしくはR₃で置換された炭素原子を表し、Zは酸素原子、酸化されても良い硫黄原子、置換されていても良い窒素原子又は置換されていても良い炭素原子を表し、

R₁、R₂は、各々独立して水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ハロC₁₋₆アルコキシ基、ハロC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルキルアミノ基、ジC₁₋₆アルキルアミノ基、C₁₋₆アルキルチオ基、ハロゲン原子またはシアノ基を表し、

R₃は水素原子、C₁₋₆アルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、ホルミル基またはアシル基を表し、また、R₂とR₃は一緒になって環を形成していても良い。

R₄はCOOR₇、COSR₇、CHO、COR₈、CH(R₉)OR₉、C(R₉)=NOR₁₀、COON=C(R₁₁)R₁₂、CR₁₃OR₁₄OR₁₅、CONR₁₆R₁₇、またはCON=C(R₁₈)NR₁₉R₂₀を表し、

Xは水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₃₋₇シクロアルキル基、ハロC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルキルチオC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルキルスルホニルC₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、C₂₋₆アルキニル基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、C₁₋₆アルキルアミノ基、アシルアミノ基、C₁₋₆アルキルスルホニルアミノ基、イミノ基、ヒドロキシ基、カルボキシ基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、C₁₋₆アル

コキシ基、置換されても良いベンジルオキシ基、 C_{2-6} アルケニルオキシ基、 C_{2-6} アルキニルオキシ基、ハロ C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} アルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、 C_{2-6} アルケニルチオ基、 C_{2-6} アルキニルチオ基、アシルオキシ基、カルバモイルオキシ基、チオカルバモイルオキシ基、アミノオキシ基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されても良いフェニルチオ基、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基、置換されても良いヘテロ環オキシ基またはヘテロ環チオ基を表し、

又、2つのXで炭素環、又は複素環を形成してもよく、mは1～4の整数を表し、

YはO、S、CO、CS、 CR_5 、 R_5 、 $C=NR_6$ または NR_6 を表し、

nは0～3の整数を表し、

R_5 、 R_5 は、各々独立して水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{3-7} シクロアルキル基、ハロ C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルキルチオ C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、 C_{1-6} アルキルアミノ基、アシルアミノ基、 C_{1-6} アルキルスルホニルアミノ基、ヒドロキシ基、カルボキシ基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシ基、置換されても良いベンジルオキシ基、 C_{2-6} アルケニルオキシ基、 C_{2-6} アルキニルオキシ基、ハロ C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} アルキルチオ基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、 C_{2-6} アルケニルチオ基、 C_{2-6} アルキニルチオ基、アシルオキシ基、カルバモイルオキシ基、チオカルバモイルオキシ基、アミノオキシ基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されても良いフェニルチオ基、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基、置換されても良いヘテロ環オキシ基またはヘテロ環チオ基を表し、又、 R_5 と R_5 は一緒になって環を形成しても良く、

R_6 は水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{3-7} シクロアルキル基、ハロ C_{1-6} ア

ルキル基、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルキルチオ C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、アシル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル基、 C_{2-6} アルケニルチオ基、 C_{2-6} アルキニルチオ基、アシルオキシ基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されても良いヘテロ環基、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基又は置換されても良いヘテロ環カルボニル基を表し、

R_7 は水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{3-7} シクロアルキル基、ハロ C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルキル基、フェノキシ C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルキルチオ C_{1-6} アルキル基、フェニルチオ C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルキルスルフィニル C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル C_{1-6} アルキル基、フェニルスルホニル C_{1-6} アルキル基、ハロ C_{1-6} アルキルスルホニル C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{3-6} アルキニル基、シアノ C_{1-6} アルキル基、アミノ C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アシルオキシ C_{1-6} アルキル基、ベンゾイルオキシ C_{1-6} アルキル基、ヘテロ環で置換されたカルボニルオキシ C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニルオキシ C_{1-6} アルキル基、チオ C_{1-6} アシルオキシ C_{1-6} アルキル基、モノアルキルアミノ基、アシルアミノ基、アルキリデンアミノ基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基またはヘテロ環基を表し、

R_8 は C_{1-6} アルキル基、 C_{3-7} シクロアルキル基、ハロ C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルキルチオ C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルキルスルホニル C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、 C_{2-6} アルキニル基、アシル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、 C_{1-6} アルキルチオ基、 C_{2-6} アルケニルチオ基、 C_{2-6} アルキニルチオ基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されても良いヘテロ環基、置換されても良いベンゾイル基または置換されても良いヘテロ環カルボニル基を表し、

R₉ 及び R₁₀ はそれぞれ独立して、水素原子、C₁₋₆ アルキル基、C₃₋₇ シクロアルキル基、ハロ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルキルチオ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルキルスルホニル C₁₋₆ アルキル基、C₂₋₆ アルケニル基、C₂₋₆ アルキニル基、アシル基、C₁₋₆ アルコキシカルボニル基、C₁₋₆ アルキルスルホニル基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されても良いヘテロ環基、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基または置換されても良いヘテロ環カルボニル基を表し、

R₁₁ 及び R₁₂ はそれぞれ独立して、水素原子、C₁₋₆ アルキル基、C₃₋₇ シクロアルキル基、ハロ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルキルチオ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルキルスルホニル C₁₋₆ アルキル基、C₂₋₆ アルケニル基、C₂₋₆ アルキニル基、アシル基、C₁₋₆ アルコキシカルボニル基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されても良いヘテロ環基、置換されても良いベンゾイル基又は置換されても良いヘテロ環カルボニル基を表し、又、R₁₁ と R₁₂ で環を形成しても良い。

R₁₃ は水素原子、C₁₋₆ アルキル基、C₃₋₇ シクロアルキル基、ハロ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルキルチオ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルキルスルホニル C₁₋₆ アルキル基、C₂₋₆ アルケニル基、C₂₋₆ アルキニル基、C₁₋₆ アルコキシカルボニル基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基または置換されても良いヘテロ環基を表し、

R₁₄ 及び R₁₅ はそれぞれ独立して、C₁₋₆ アルキル基、C₃₋₇ シクロアルキル基、ハロ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルキルチオ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルキルスルホニル C₁₋₆ アルキル基、C₂₋₆ アルケニル基または C₂₋₆ アルキニル基を表し、又、R₁₄ と R₁₅ で環を形成しても良い。

R₁₆ 及び R₁₇ はそれぞれ独立して、水素原子、C₁₋₆ アルキル基、C₃₋₇ シクロアルキル基、ハロ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ アルキル基、C

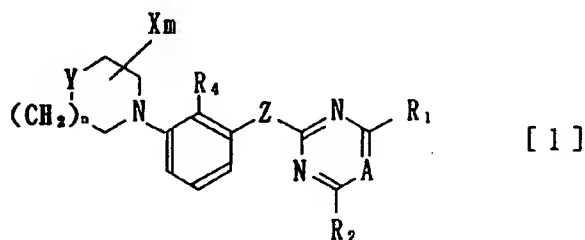
1-6 アルキルチオ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルキルスルホニル C₁₋₆ アルキル基、C₂₋₆ アルケニル基、C₂₋₆ アルキニル基、アシル基、C₁₋₆ アルコキシカルボニル基、C₁₋₆ アルキルスルホニル基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されても良いヘテロ環基、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基又は置換されても良いヘテロ環カルボニル基を表し、又、R₁₆とR₁₇で環を形成しても良い。

R₁₈は水素原子、C₁₋₆ アルキル基、C₃₋₇ シクロアルキル基、ハロ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルキルチオ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルキルスルホニル C₁₋₆ アルキル基、C₂₋₆ アルケニル基、C₂₋₆ アルキニル基、ハロゲン原子、シアノ基、アミノ基、C₁₋₆ アルキルアミノ基、アシルアミノ基、C₁₋₆ アルキルスルホニルアミノ基、ヒドロキシ基、C₁₋₆ アルコキシカルボニル基、C₁₋₆ アルコキシ基、置換されても良いベンジロキシ基、C₂₋₆ アルケニロキシ基、C₂₋₆ アルキニロキシ基、ハロ C₁₋₆ アルコキシ基、C₁₋₆ アルキルチオ基、C₁₋₆ アルキルスルホニル基、C₂₋₆ アルケニルチオ基、C₂₋₆ アルキニルチオ基、アシロキシ基、カルバモイルオキシ基、チオカルバモイルオキシ基、アミノオキシ基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されても良いヘテロ環基、置換されても良いフェニルチオ基、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基、置換されても良いヘテロ環オキシ又はヘテロ環チオ基を表し、

R₁₉及びR₂₀はそれぞれ独立して、水素原子、C₁₋₆ アルキル基、C₃₋₇ シクロアルキル基、ハロ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルコキシ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルキルチオ C₁₋₆ アルキル基、C₁₋₆ アルキルスルホニル C₁₋₆ アルキル基、C₂₋₆ アルケニル基、C₂₋₆ アルキニル基、アシル基、C₁₋₆ アルコキシカルボニル基、C₁₋₆ アルキルスルホニル基、カルバモイル基、チオカルバモイル基、置換されても良いベンジル基、置換されても良いフェニル基、置換されても

良いヘテロ環基、置換されても良いフェニルスルホニル基、置換されても良いベンゾイル基又は置換されても良いヘテロ環カルボニル基を表し、 R_{19} と R_{20} で炭素環若しくは複素環を形成しても良い。]

2. 一般式〔1〕で表される化合物を含有することを特徴とする除草剤。




(式中、A、Z、 R_1 、 R_2 、 R_4 、X、Y、m及びnは前記と同じ意味を表す。)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP96/01262

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int. C1 ⁶ C07D239/42, C07D239/46, C07D239/47, C07D239/48, C07D251/34, C07D491/048, C07D251/38, C07D413/12, A01N43/54, A01N43/60, A01N43/66 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int. C1 ⁶ C07D239/42, C07D239/46, C07D239/47, C07D239/48, C07D251/34, C07D491/048, C07D251/38, C07D413/12, A01N43/54, A01N43/60, A01N43/66 Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) CAS ONLINE		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP, 2-164862, A (Mitsui Toatsu Chemicals, Inc.), June 25, 1990 (25. 06. 90), Claim (Family: none)	1 - 2
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier document but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search July 23, 1996 (23. 07. 96)		Date of mailing of the international search report July 30, 1996 (30. 07. 96)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office Facsimile No.		Authorized officer Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC)) Int cl' C07D239/42, C07D239/46, C07D239/47, C07D239/48, C07D251/34, C07D491/048, C07D251/38, C07D413/12 , A01N43/54, A01N43/60, A01N43/66		
B. 調査を行った分野 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC)) Int cl' C07D239/42, C07D239/46, C07D239/47, C07D239/48, C07D251/34, C07D491/048, C07D251/38, C07D413/12 , A01N43/54, A01N43/60, A01N43/66		
最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの		
国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語) CAS ONLINE		
C. 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	JP, 2-164862, A (三井東圧化学株式会社), 25. 6月. 1990 (25. 06. 90), 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	1-2
<input type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。		
* 引用文献のカテゴリー 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願日の後に公表された文献 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」同一パテントファミリー文献		
国際調査を完了した日 23. 07. 96	国際調査報告の発送日 30.07.96	
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/J P) 郵便番号 100 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 内藤 伸一  4C 8615 電話番号 03-3581-1101 内線 3452	